



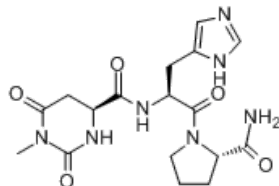
本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[103300-74-9](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](#)

CAS Number:103300-74-9 基本信息

中文名:	他替瑞林; (4S)-N-[(2S)-1-[(2S)-2-氨基甲酰基吡咯烷-1-基]-3-(3H-咪唑-4-基)-1-氧代丙-2-基]-1-甲基-2,6-二
英文名:	Taltirelin
别名:	(4S)-N-[(2S)-1-[(2S)-2-Carbamoylpyrrolidin-1-yl]-3-(3H-imidazol-4-yl)-1-oxopropan-2-yl]-1-methyl-2,6-dioxo-1,3-diazinane-4-carboxamide

分子结构:



分子式:	C ₁₇ H ₂₃ N ₇ O ₅
分子量:	405.41
CAS登录号:	103300-74-9

CAS#103300-74-9化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

供应商信息已更新, 请登录爱化学 [CAS No. 103300-74-9](#) 查看

若您是此化学品供应商, 请按照[化工产品收录](#)说明进行免费添加

其他信息

产品应用:	他替瑞林(103300-74-9)的用途: 是促甲状腺素释放激素类似物, 主要用于治疗罕见病症脊髓小脑变性。
生产方法及其他:	他替瑞林(103300-74-9)的制备方法: 1-甲基-L-4, 5-二 氟 乳清 酸 和N-羟基丁二酰亚胺溶于 二甲基甲酰胺 , 在0℃加入二环己基炭化二亚胺, 搅拌1.5h。加入L-组氨酸-L-脯氨酸二氢溴酸盐和 三乙胺 , 在0~15℃搅拌2天。滤去不溶物, 滤液减压浓缩以移去二甲基甲酰胺。剩余物溶于稀 盐酸 , 滤去不溶物, 滤液用 氯仿 洗, 用 碳酸氢钠 碱化。通过装有 苯乙烯 和二 乙烯基 的共聚物的柱子, 水 洗后, 再用水洗脱。收集含产物的洗脱液, 冰干, 再用水结晶和重结晶, 真空干燥, 得产物。 作用机制: 促甲状腺素释放激素(TGH)除具有内分泌作用外, 还可发挥一定的中枢神经系统(CNS)作用, 包括提高运动性, 拮抗利舍平诱导的体温降低, 以及拮抗戊巴比妥诱导的睡眠。此外, 在动物CNS疾病模型中的药理学研究显示THR可改善抑郁, 血循环性休克, 意识紊乱, 记忆力减退和运动技能障碍。然而, 临床研究显示因TRH在体内快速代谢降解, 作用时间较短。另外, TRH产生内分泌作用的剂量远低于对CNS的起效剂量, 因而临床应用受到限制。本品为合成的TRH类似物。药理学研究显示本品经由脑TRH受体对CNS产生强而持久的多重作用。本品对CNS的兴奋作用比TRH强10~100倍, 作用持续时间比TRH长约8倍。本品对TRH受体的亲和力约为TRH 的1/11, 因而本品的内分泌作用比TRH弱, 但本品在体内比TRH稳定。另外, 本品对促甲状腺素(TSH)释放的作用为TRH的1/6~1/11。TSH释放是由一个包括甲状腺激素的强负反馈系统调节的。该负反馈系统也会抑制本品潜在的内分泌作用。 药代: 本品口服后经小肠吸收。健康成年男性志愿者一次接受本品0.5~40mg口服, 约3~5小时可达血药峰值, 食

	物可使本品的吸收减少25%，并降低药物的血浆浓度。本品的代谢类似于TRH，主要通过肾脏随尿排泄，T1/2约为2～4小时。重复给药未见药物蓄积。 临床试验： 一项为期6周的随机双盲安慰剂对照双向交叉Ⅱ期临床研究在60例脊髓小脑变性病人中进行。经过2周的观察后，病人分成两组，一组接受本品一日2次，每次20mg，连用2周，随后2周接受安慰剂；另一组先接受安慰剂2周，随后2周接受本品。结果显示，本品组整体改善率优于安慰组(P=0.0394)。本品组在指鼻试验和tapping-point试验中是神经评分方面显示优于安慰剂组的倾向。本品对自发性动作和总的精神状态的改善也优于安慰剂(分别为P=0.0448;P=0.0296)。 一项双盲随机安慰剂对照Ⅲ期临床研究中，427例脊髓小脑变性病人随机接受本品一日2次，每次5mg或安慰剂，连用28~52周。28周时的整体改善率优于安慰剂组(P<1.001)。本品组累计变化率为27.7%，而安慰剂组为47.1%，共济失调的总改善率本品组显著优于安慰剂组(P<0.004)。本品组共济失调累计变化率为27.1%，而安慰剂组为39.4%。本品组的不良反应发生率为14.1%，与安慰剂组几乎相等。 不良反应： 本品不良反应主要是消化系统反应，包括呕吐、恶心、和胃不适。所有的不良反应均为轻中度，在治疗期间及(或)停药后消失。 注意事项： 肾功能受损者慎用。
--	---

相关化学品信息

10237-77-1	104139-53-9	101531-76-4	109532-22-1	107783-51-7	101516-99-8	108549-45-7	己可碱	10378-79-
7	104502-47-8	10535-04-3	109030-96-8	100005-41-2	10210-18-1	100390-48-5	447	

生成时间2021/4/5 7:33:12