



本PDF文件由 爱化学 IChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[107753-78-6](#), 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](#)

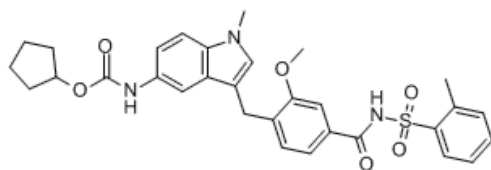
CAS Number:107753-78-6 基本信息

中文名: 扎鲁司特;
[3-[2-甲氧基-4-[(2-甲基)磺酰胺基甲酰基]苄基]-1-甲基-吡啶-5-基]氨基甲酸环戊酯

英文名: Zafirlukast

别名: Cyclopentyl N-[3-{[2-methoxy-4-[(2-methylphenyl) sulfonylcarbamoyl]phenyl]methyl}-1-methyl-indol-5-yl]carbamate;
Cyclopentyl [3-[[2-methoxy-4-[(2-methylphenyl) sulfonylcarbamoyl]phenyl]methyl]-1-methyl

分子结构:



分子式: C₃₁H₃₃N₃O₆S

分子量: 575.68

CAS登录号: 107753-78-6

物理化学性质

熔点: 139°C

CAS#107753-78-6化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 专业从事107753-78-6及其他化工产品的生产销售 021-61552785

供应商信息已更新且供应商的链接失效, 请登录爱化学 [CAS No. 107753-78-6](#) 查看

若您在此化学品供应商, 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: 扎鲁司特(107753-78-6)的用途:
白三烯拮抗剂。
用于治疗哮喘。
此信息由

生产方法及其他:

扎鲁司特(107753-78-6)的生产方法:
5-硝基吡啶(I, 5.0g, 30.8mmol)和4-(溴甲基)-3-甲氧基苯甲酸甲酯(II, 7.99g, 30.8mmol)溶于30ml二氧六环, 在氮气保护和搅拌下加入氧化银(7.15g, 30.8mmol), 在60°C下加热20h。减压蒸出溶剂, 加入50ml乙酸乙酯。过滤, 滤液浓缩, 再用层析分离, 以3: 7的乙酸乙酯-己烷洗脱。得到的黄色油状物再用二氯甲烷-己烷结晶, 得4.6g化合物(III), 收率45%, 熔点153~155°C。
在氮气保护下, 将化合物(III) (0.44g, 1.29mmol)加到已游离的氢化钠(0.031g, 1.29mmol)在100ml干燥四氢呋喃的悬浮液中, 在10min后再加入碘甲烷(0.18g, 1.29mmol), 反应30min。倾入30ml 1mol/L盐酸, 用乙酸乙酯(2×50ml)提取。提取液用饱和盐水洗, 干燥, 浓缩。经层析分离, 以50: 45: 5的己烷-二氯甲烷-乙酸乙酯洗脱, 得到的黄色油状物经二氯甲烷和己烷的混合液结晶, 得0.33g化合物(IV), 收率72%, 熔点144~146°C。

| | |
|--|-----------------------------|
| <p>化合物(IV) (0.56g, 1.57mmol)溶于30ml四氢呋喃,加入0.1g10%钯-碳催化剂,在0.345MPa的氢压下加氢2h。过滤,滤液浓缩,再经层析提纯,以1:1的乙酸乙酯-己烷洗脱,得0.5g化合物(V),收率98%。</p> <p>化合物(V) (0.25g, 0.77mmol)和N-甲基吗啉(0.77mmol)溶于3ml二氯甲烷,在氮气保护下加入氯甲酸环戊基酯(0.11g, 0.77mmol),搅拌2h。倾入1mol/L盐酸,用乙酸乙酯提取。提取液用饱和盐水洗,干燥,浓缩。剩余黏稠油状物用层析提纯,以3:7的乙酸乙酯-己烷洗脱,得0.25g化合物(VI),收率74%。</p> <p>化合物(VI)用氢氧化锂在室温进行水解,得到化合物(VII)。(VII)和邻甲基苯磺酰胺,在1-[3-(二甲胺)丙基]-3-乙基碳化二亚胺盐酸盐和4-(二甲胺基)吡啶存在下,在二氯甲烷中缩合,可得扎夫司特,收率69%,熔点138~140℃。</p> <p>扎鲁司特(107753-78-6)的药理作用:</p> <p>本品作为一种多肽性LTC4、LTD4、LTE4等超敏反应慢反应物质的白三烯受体拮抗剂,竞争性抑制白三烯活性,有效地预防白三烯多肽所致的血管通透性增加而引起的气道水肿,同时抑制白三烯多肽产生的气道嗜酸细胞的浸润,减少气管收缩和炎症,减轻哮喘症状。本品具有高度选择性,仅作用于白三烯受体,不影响前列腺素、血栓素、胆碱能及组胺受体。口服吸收良好,服后约3h血浆浓度达峰值。服药2h内,药物血浆浓度尚未达到峰值时便可在基础支气管运动张力上产生明显的首剂效应。血浆蛋白结合率为99%,尿排泄为口服剂量的10%,大便排泄为89%,消除半衰期约为10h。药代动力学在正常人群和肾损害患者无显著差异。与食物同时大部分患者(75%)的生物利用度降低,其降低幅度可达40%。</p> <p>扎鲁司特(107753-78-6)的用法用量:</p> <p>本药用于预防哮喘发作,因此应持续使用。成人和12岁以上(包括12岁)儿童 起始剂量应是20mg bid,一般维持剂量为20mg bid,剂量逐步增加至一次最大量40mg,每日二次时可能疗效更佳,用药剂量不应超过最大推荐量。因为食物能降低扎鲁司特的生物利用度,应避免本药在进食时服用。老年人 65岁以上的老年人对扎鲁司特的清除率降低,因而峰浓度(Cmax)和曲线下面积(AUC)大约是年轻人的2倍,然而尚无资料证明扎鲁司特在老年人的蓄积。临床用药时,老年人在用量20mg bid的情况下,不会增加药物的副作用或因副作用而停药。老年人的起始剂量应为20mg bid,然后根据临床反应调整用量。儿童 本药对12岁以下儿童的疗效和安全性目前尚无报道。肾功能不全者不需调整剂量。在酒精性肝硬化稳定期患者,扎鲁司特清除率降低,峰浓度(Cmax)和曲线下面积(AUC)大约为正常人的2倍。起始剂量应是20mg bid,然后根据临床反应调整。尚未对本药在其它原因所致的肝功能损害病人中的应用进行观察,也未对肝硬化患者进行长期观察。</p> <p>扎鲁司特(107753-78-6)的注意事项:</p> <p>对本药及其组分过敏者禁用。在哮喘的缓解期,仍应按时服用本药以保证疗效。在急性发作期,通常仍应维持本药治疗。与吸入糖皮质激素和色甘酸类药(色甘酸二钠,奈多罗米纳)相同,本药不适用于解除哮喘急性发作时的支气管痉挛。有关本药治疗易变性哮喘或不稳定性哮喘的研究尚未报道。不宜用本药突然替代吸入或口服的糖皮质激素。在重度哮喘患者的治疗中,在考虑减少激素用量时应谨慎。在停用口服激素的重度哮喘病人中,极少数发生嗜酸细胞浸润,偶表现为以全身血管炎为临床特点的Churg-Strauss综合征。但尚未发现本药与此综合征之间有因果关系。使用本药治疗期间,血清转氨酶有可能升高,通常表现短暂而无症状,但可能是肝毒性的早期表现。如有肝功能不全的症状或体征(如:恶心、呕吐、右上腹疼痛、疲倦、嗜睡、流感样症状、肝肿大、瘙痒及黄疸)出现,应该测定血清转氨酶,尤其是血清ALT,且随后对患者进行处理。是否中断本药治疗应在权衡肝功能损害和使用本药之间的利弊后,依个体情况决定。本药不被推荐用于肝硬化在内的肝功能损害病人。动物试验证明扎鲁司特不影响生育能力,无致畸作用和对胎儿的毒性作用。然而,尚未研究妊娠妇女服用本药的安全性,故妊娠期持续用药应权衡利弊。仅在确实需要时才使用本药。</p> <p>此信息由</p> | |
| 相关化学品信息 | |
| 10098-82-5 | 103000-69-7 |
| 101670-73-9 | 钼酸铅 |
| 108734-90-3 | 101060-97-3 |
| 乙酞辅酶A钠盐 | 102916-85-8 |
| 102203-17-8 | 100231-64-9 |
| 102038-06-2 | 10045-38-2 |
| 104071-75-2 | 101198-11-2 |
| 1082041-34-6 | 450 |

生成时间2021/2/28 19:18:32