

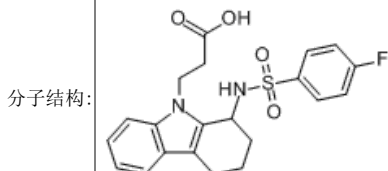


本PDF文件由 www.ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[116649-85-5](http://www.ichemistry.cn), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](http://www.ichemistry.cn)

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](http://www.ichemistry.cn)

CAS Number:116649-85-5 基本信息

中文名:	雷马曲班; 3R-(4-氟苯磺酰氨基)-1,2,3,4-四氢化-9H-咔唑-9-丙酸
英文名:	Ramatroban
别名:	3R-[[(4-Fluorophenyl) sulfonyl] amino]-1,2,3,4-tetrahydro-9H- carbazole-9-propanoic acid



分子式:	C ₂₁ H ₂₁ FN ₂ O ₄ S
分子量:	416.47
CAS登录号:	116649-85-5

CAS#116649-85-5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116649-85-5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. 116649-85-5](http://www.ichemistry.cn) 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: 雷马曲班(116649-85-5)的用途:
是一种血栓素A₂抑制剂, 主要用于治疗过敏性鼻炎。

生产方法及其他: 雷马曲班(116649-85-5)的制备方法:
4-氨基环己醇和三乙胺溶于四氢呋喃, 滴加4-氟苯磺酰氯, 反应得4-(4-氟苯磺酰胺基)环己醇。将其溶于冰乙酸, 在0~5℃滴加三氧化铬的乙酸水溶液, 搅拌反应, 氧化得4-(4-氟苯磺酰胺基)环己酮。将其和苯肼溶于冰乙酸, 回流4h。加入乙醚和水, 冷却和搅拌下, 用45%氢氧化钠溶液碱化。分出有机层, 水层用乙醚提取。有机层合并, 干燥, 浓缩。剩余物硅胶柱层析, 得4-(4-氟苯磺酰胺基)-1,2,3,4-四氢呋喃。该化合物和丙烯腈溶于二氧六环, 加入苄基三甲基氯化铵, 在60~70℃反应2h。真空浓缩, 剩余物溶于二氯甲烷, 用稀硫酸提取。有机层用饱和碳酸氢钠溶液洗, 干燥, 过滤。滤液浓缩, 得3-[N-(4-氟苯磺酰胺基)-N-(2-氰乙基)胺基]-9-(2-氰乙基)-1,2,3,4-四氢呋喃。该化合物溶于异丙醇。加入10%氢氧化钾溶液, 在70℃搅拌4h。加入水, 用二氯甲烷提取。水层用稀硫酸酸化后, 用二氯甲烷提取。提取液干燥, 浓缩。该剩余物即为雷马曲班。将其溶于甲醇, 加入甲醇钠的甲醇溶液。浓缩, 得雷马曲班钠。

药理毒理:

(德)Bayer公司研制, 2001年5月首次在日本上市。血栓烷(Tx)_{A₂}及其前体—前列腺素内过氧化物(H₂PGH₂)均作用于同一受体, 具有极强的血管、支气管平滑肌收缩作用和血小板活化作用。Tx_{A₂}主要在血小板中形成, 但也可由其它细胞和组织如肺、多形核白细胞和人血管产生。据认为Tx_{A₂}是血栓性疾病、心、脑血管病和支气管哮喘的重要病理生理学介质。在心血管疾病中可见Tx_{A₂}释放增加。过敏原诱发哮喘的病人其支气管肺泡灌洗液含有的Tx_{B₂}(Tx_{A₂}的稳定降解产物)、前列腺病(PG)D₂、PG₂α和9α、11βPGF浓度显著升高。被动致敏的人肺部在过敏原的激发下释放大量的前列腺素类激素, 进而激活肥大细胞释放大量的PGD₂。本品为高效的选择性Tx_{A₂}/PGH₂受体拮

抗剂，可与平滑肌和血小板的 TxA_2 受体特异性结合。本品的抗过敏反应基于抑制血管通透性和鼻粘膜高敏性及防止其它炎症反应发生。

临床评价：

1. 一项双盲III期临床研究中，203例中重度常年性过敏性鼻炎为病人随机每日接受本品150mg或特非那定120mg，一日2次。中度以上的改善本品组为67.4%，特非那定组为43.0%。与特非那定相比，本品可使鼻塞和因鼻症状所致的日常不适感显著改善。本品组和特非那定组的不良反应发生率分别为5.3%和3.4%。本品组5.3%的病人临床检验异常，而特非那定组为6.7%。

2. 33例伴有鼻塞的常年性过敏性鼻炎病人每日接受本品150mg，分二次服用，连用4周，鼻塞显著减轻。

3. 长期给药研究中，92例病人每日接受本品150mg(必要时可减至一日100mg)，连用24周。不良反应发生率为8.7%，其中消化道症状最多(10例)，其次为皮肤相关症状(2例)。6.5%的病人临床检验异常，可见GOP、GTP和胆红素等升高。

药动学：

健康志愿者口服本品后吸收迅速，约1小时达血药峰值。本品在肝脏中代谢，主要随胆汁经粪便排泄，随尿液排出的仅为给药量的8%。终末半衰期约为2~3小时。

不良反应：

本品的不良反应包括GOP、GTP和胆红素升高、紫斑、凝血酶原时间(PT)/活化部分凝血活酶原时间(APTT)延长、皮下出血、腹泻、腹痛、消化不良和头痛等。

用法用量：

成人一日2次，每次75mg，早餐和晚餐后(或临睡前)口服。

注意事项：

有出血倾向者、妇女月经期间、肝损伤者和老年人慎用。本品可与抗血小板药如噻氯匹定，血栓溶解药如尿激酶，抗凝药如肝素、华法林，[水杨酸](#)类制剂如阿司匹林，以及茶碱发生相互作用。

相关化学品信息

[116719-38-1](#) [1138-47-2](#) [114460-37-6](#) [113855-44-0](#) [1174-98-7](#) [119395-11-8](#) [110719-58-9](#) [117983-11-6](#) [1121-54-6](#) [119121-90-3](#) [2-己基吡啶](#) [4-氯-6-\(1H-咪唑-1-基\)嘧啶](#) [110254-69-8](#) [113518-54-0](#) [N-甲基-N-甲氧基-4-氟苯甲酰胺](#) [110933-26-1](#) [1199-36-6](#) [110576-16-4](#) [111138-44-4](#) [1117-97-1](#) [110924-84-0](#) [111509-16-1](#) [112088-61-6](#) [依酚氯铵](#) [1185241-28-4](#) [119292-92-1](#) [益果](#) [110802-65-8](#) [119513-57-4](#) [118920-68-6](#)

生成时间2021/4/7 9:43:47