



本PDF文件由 爱化学 iChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[143322-58-1](#), 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](#)

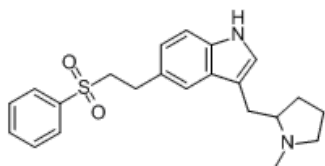
CAS Number:143322-58-1 基本信息

中文名: 依来曲普坦;
来曲普坦;
依利曲坦;
3-[(1-甲基吡咯烷-2-基) 甲基]-5-(2-苯基磺酰乙基)-1H-吲哚

英文名: Eletriptan

别名: 3-[(1-Methylpyrrolidin-2-yl)methyl]-5-(2-phenylsulfonyl ethyl)-1H-indole

分子结构:



分子式: C₂₂H₂₆N₂O₂S

分子量: 382. 52

CAS登录号: 143322-58-1

CAS#143322-58-1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. 143322-58-1](#) 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:

依利曲坦(143322-58-1)的用途:
它是选择性5-HT_{1B}/1D受体激动剂。主要用于治疗急性偏头痛发作。

生产方法及其他:

1. 依利曲坦(143322-58-1)的生产方法:

①(R)-5-溴-3-(N-甲基吡咯啉-2-基甲基)-1H-吲哚溶于二甲基甲酰胺和三乙胺, 加入乙酸酐, 反应10min, 再在90~100℃反应2h。冷却, 加到由乙酸钡、三甲基膦、苯基乙烯基硫酸和三乙胺组成的混合液中, 回流3h。冷却, 过滤, 加入稀盐酸, 再用氢氧化钠溶液调pH值至8。过滤收集沉淀, 水洗, 真空干燥, 得(R)-1-乙酰基-5-(2-苯磺酰基乙烯基)-3-(N-甲基吡咯啉-2-基甲基)-1H吲哚。

②该化合物溶于丙酮, 加入水, 滴加甲磺酸, 搅拌5min后, 加入5%钡-炭, 在室温氢化18h。滤去催化剂, 滤液完全蒸出丙酮, 滴加40%氢氧化钠溶液和水, 搅拌20min后再加入40%氢氧化钠溶液, 剧烈搅拌2h。过滤, 干燥, 得固体, 溶于丙酮和甲醇, 加入碳酸钾, 搅拌24h。加入活性炭, 1h后再加入无水硫酸镁, 搅拌1h。过滤, 滤液浓缩至干, 剩余物真空干燥, 得产物依利曲坦(143322-58-1)。

2. 依利曲坦(143322-58-1)的适应症:

适用于成人有或无先兆的偏头痛的急性治疗。

3. 依利曲坦(143322-58-1)的药理:

本品是有效的血管选择性5-HT_{1B}和神经元5-HT_{1D}受体激动剂, 本品对5-HT_{1D}受体的亲和力比舒马普坦(Imigran, Imitrex)高6倍, 对5-HT_{1B}的亲和力比舒马普坦高3倍。本品还对5-HT_{1F}受体有高度亲和力。

人体5-HT_{1B}受体介导颅内血管收缩。5-HT_{1D}受体主要位于三叉神经末梢突触前。最近研究显示5-HT_{1B}和5-HT_{1F}受体位于人体三叉神经中枢。本品可能通过激活上述受体来抑制神经肽的释放, 从而产生疗效。

本品对人体5-HT_{1A}、5-HT_{2B}、5-HT_{1E}和5-HT₇受体有中度亲和力, 对其它多种受体(β受体、腺苷A₁, 多巴胺D₁, D₂, 毒蕈碱和阿片受体)。

及钙通道二氢吡啶结合位点无亲和力或药理活性。 动物试验显示，本品对颈动脉、冠状动脉和股动脉血管床的选择性高于舒马普坦。此外，本品可抑制动物硬脑膜中的神经性炎症。由此，本品可能通过收缩颅内血管并抑制神经性炎症来发挥抗偏头痛效应。 本品的亲脂性比舒马普坦和其它现有的曲坦类药物强，能透过血脑屏障。 本品口服后经胃肠道迅速吸收，约1.5小时达血药峰值，舒马普坦为2.5小时。本品口服的绝对生物利用度约为50%，舒马普坦为15%。 本品主要经由细胞色素P450酶CYP3A4代谢。消除t_{1/2}约为4小时。 4. 临床评价： 在一项包括1151例偏头痛患者的III期临床研究中，本品40和80mg组，给药2小时后，分别有62%和65%的患者从中重度头痛减轻至轻度或无痛，而安慰剂组为19%。本品两个剂量的起效时间分别为30和60分钟。 在一项本品与舒马普坦的直接比较研究中，给药后1小时内，本品20、40和80mg组，分别有24%、38%和41%的患者从中重度头痛减轻至轻度或无头痛，而100mg舒马普坦组为20%。2小时时，本品组77%的患者为轻度头痛或无头痛，而舒马普坦组为55%。4小时时，相应的本品组为58%，舒马普坦组为46%。 5. 不良反应： 临床研究中，本品最常见的不良反应为乏力、嗜睡、恶心和眩晕。 6. 依利曲坦(143322-58-1)的注意事项： 对本品及制剂成分过敏者禁用本品。严重肝、肾受损者，高血压未控制者、冠心病、周围血管病、有脑血管意外(CVA)或暂时性局部缺血发作(TIA)史的患者禁用。轻中度肾脏受损者及怀孕、哺乳期妇女慎用。 本品不可与麦角胺、麦角胺衍生物(包括美西麦角)或其它5-HT₁受体激动剂同时使用。 7. 剂量与用法： 成人偏头痛发作后应尽早给予本品，推荐初始剂量为40mg，用水吞服。如果在24小时内头痛复发，可重复给药一次，但两种剂量之间至少间隔2小时，最大日剂量为80mg。 对于正在服用红霉素和其它CYP3A4抑制剂如同酮康唑、伊曲康唑、克拉霉素的患者，推荐剂量为20mg，最大日剂量为40mg。 8. 制剂： 薄膜包衣片，每片含本品20、40或80mg。	
相关化学品信息	
4-乙基苄氯 (三氟甲氧基)苯甲醛 0 41-9 142795-23-1 146931-13-7 14474-16-9 14913-49-6 141957-35-9 143415-31-0 140448-31-3 14333-20-1 3-乙酰基氨基-2-异丙基-4(3H)-喹唑啉酮 14673-04-2 14510-67-9 14770-86-6 143016-87-9 144110-38-3 149489-32-7 14304-72-4 147090-72-0 14356-56-0 143066-75-5 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 140423-97-8 14360-00-0 142450-04-2 2-甲氧基-5- 144913-86- 143-82-8 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 5-氯-7-甲基靛红 147057-15-6 142450-04-2 14334-41-9 14746-84-0 14333-20-1 14770-86-6 14304-72-4 <	