

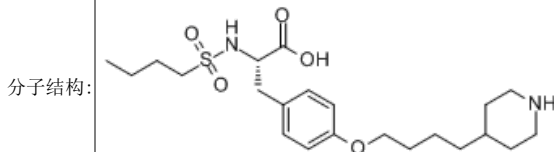


本PDF文件由 爱化学 IChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[144494-65-5](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:144494-65-5 基本信息

中文名:	替罗非班; (2S)-2-(丁基磺酰氨基)-3-[4-[4-(4-哌啶基)丁氧基]苯基]丙酸
英文名:	Tirofiban
别名:	(2S)-2-(Butylsulfonylamino)-3-[4-[4-(4-piperidyl)butoxy]phenyl]propanoic acid



分子式:	C ₂₂ H ₃₆ N ₂ O ₅ S
分子量:	440.60
CAS登录号:	144494-65-5

CAS#144494-65-5化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 专业从事144494-65-5及其他化工产品的生产销售 0712-2580635 15527768836
大连美仑生物技术有限公司 替罗非班专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0411-82593631、82593920

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. 144494-65-5](#) 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:	替罗非班(144494-65-5)的用途: 抗血栓形成药。 用于治疗不稳定的心绞痛。 特效的非肽血小板纤维蛋白原受体拮抗剂。
生产方法及其他:	替罗非班(144494-65-5)的生产方法: L-酪氨酸(I) (1040.0g, 5.74mol)、20.8L乙腈和N, O-双(三甲硅基)三氟甲基乙酰胺(BSTFA) (3103.0g, 12.05mol)混合, 温和回流2h。冷至40℃, 加入吡啶(544.8g, 6.89mol)和正丁基磺酰氯(989.0g, 6.31mol)。加毕, 在70℃反应3h, 再室温反应14h。蒸出部分溶剂, 往剩余物油状物中加入20.8L 15%硫酸氢钾, 剧烈搅拌1h。反应液用乙酸异丙酯(3×6.2L)提取。提取液合并, 加入3.12kg EcosorbTMS-402(炭和纤维素的混合物), 在22℃搅拌14h。过滤除去EcosorbTMS-402, 并用4.2L乙酸异丙酯洗滤饼。洗液和滤液合并, 浓缩至干。将剩余的黄色油溶于1.25L热乙酸乙酯, 再在搅拌下, 缓慢加入3.74 L己烷。加毕, 在室温搅拌过夜。过滤收集固体, 用乙酸乙酯-己烷(0.2L+1.89L)洗, 真空干燥, 得1457g白色固体, 即为N-正丁基磺酰基-L-酪氨酸(III), 收率84%, 熔点125~126.5℃。 4.1L四氢呋喃和4-甲基吡啶(838.2g, 9.0mol)混合, 冷至-70℃以下。缓慢加入正丁基锂(1.41mol/L, 7.02L)的己烷溶液, 并保持内温不高于-50℃, 该过程约进行1h, 最后得到有沉淀的橙色溶液。将反应液冷至0℃, 然后将其缓慢加到冷至-70℃的3-溴-1-氯丙烷(1487.8g, 9.45mol)在1.5 L四氢呋喃中的溶液, 并保持内温不高于-65℃。加毕, 缓慢升至0℃, 并放置过夜。加入9L水, 搅拌。10min, 放置分层。分出水层, 用5L乙酸异丙酯提取。有机层减压于40℃浓缩至1/3体积。冷至-10℃, 加入3L 9.0mol氯化氢的乙酸异丙酯溶液, 搅拌1h。过滤收集固体, 用四氢呋喃(总计4.5L)洗数次, 真空于氮气流中干燥, 得1710.4g白色固体, 为4-(4-吡啶基)丁基氯盐

(VI), 收率92%, 熔点119~120.5℃。

化合物(III) (1386.3g, 4.60mol)和化合物(VI) (1137.8g, 5.52mol)溶于16.56L二甲亚砜。在剧烈搅拌下, 于15min中加入3mol/L [氢氧化钾](#)水溶液(5.52L, 16.56mol)。再加入 [碘化钾](#) (7.64g, 46.0mmol), 在60~65℃下加热36h。冷至室温, 用46L0.25mol/L [氢氧化钠](#)溶液稀释后, 用23L叔丁基甲基醚提取, 提取液废弃。水层用2.0kg Ecosorb S-402和150g Nuchar SA处理, 并剧烈搅拌1h。过滤, 滤饼用69L水洗。洗液和滤液合并(约136L), 在剧烈搅拌下, 加入2.5kg [氯化钠](#)。加毕, 搅拌30min。然后加入50%乙酸水溶液至pH值为4.80(约4L), 继续搅拌2-3h。过滤收集固体, 用23L水洗, 于40℃减压和氮气下干燥20h, 得1599g米色固体, 为N-(正丁基磺酰基)-O-[4-(4-吡啶基)丁基]-L-酪氨酸(VII), 收率80%, 纯度95%。

化合物(VII) (1.051kg, 2.42mol)和10%钯-炭催化剂(53g, 5%重量)溶于14L乙酸, 在0.28MPa的氢压和60℃下, 氢化至完全(约5.5h)。过滤除去催化剂, 并用14L乙酸洗。滤液浓缩至黏稠油状, 其中约含1kg乙酸。加入15L水, 使成1g/15ml 6%乙酸水溶液, 在室温下搅拌18h。过滤收集固体, 用10L水洗, 真空于氮气流下干燥, 得1.03kg白色固体的Tirofiban, 收率97%, 熔点223-225℃。

Tirofiban(316.0g, 0.717mol)溶于9.5L乙酸异丙酯, 在室温下搅拌10~15min后, 滴加120ml浓盐酸, 滴加过程需40min, 并保持内温在19℃。加毕, 在室温下继续搅拌5h。在氮气流下过滤收集固体, 用乙酸异丙酯(2×1L)洗, 真空氮气流下干燥过夜, 得348g盐酸替洛非巴, 收率98%, 熔点131~132℃。

相关化学品信息

[143519-23-7](#) [14024-81-8](#) [14597-42-3](#) [1467-37-4](#) [143066-75-5](#) [海克替啶](#) [144365-95-7](#) [142402-62-8](#) [1-\(3-溴丙氧基\)-2-氟苯](#) [3-氨基苯乙酸](#) [5-甲基糠胺](#) [14006-32-7](#) [145328-93-4](#) [145277-31-2](#) [141018-30-6](#) 438

生成时间2021/3/7 11:57:00