

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.chemistry.cn](#)

CAS Number:38194-50-2 基本信息

中文名:	舒林酸; (Z)-5-氟-2-甲基-1-[4-(甲亚硫酰苯基)亚甲基]-1H-茚-3-醋酸
英文名:	Sulindac
别名:	(Z)-5-Fluoro-2-methyl-1-[p-(methylsulfinyl)benzylidene]indene-3-acetic acid
分子结构:	
分子式:	C ₂₀ H ₁₇ FO ₃ S
分子量:	356.41
CAS登录号:	38194-50-2
EINECS登录号:	253-819-2

物理化学性质

性质描述:	舒林酸 (38194-50-2) 的性状: 1. 黄色结晶, 无臭无味; 2. 易潮解; 3. 微溶于 <u>乙醇</u> 、 <u>丙酮</u> 、 <u>乙酸乙酯</u> 或 <u>氯仿</u> , 难溶于 <u>甲醇</u> ; 4. 在pH值<4.5时几不溶于 <u>水</u> , 溶解度随pH值增加而增加, 在pH值为7时, 约3.0mg/mL。熔点182~185°C (分解); 5. UV最大吸收 (0.1mol/L氯化氢的甲醇溶液): 327, 285, 256, 226nm (E ^{1%} _{1cm} 375, 420, 410, 540), pK _a (25°C) 4.7。
-------	---

安全信息

危险品标:	
危险类别码:	Xn: 有害物质 R22: 吞咽有害。

CAS#38194-50-2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. 38194-50-2](#) 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:	消炎镇痛药, 用于风湿性、类风湿性关节炎、急性痛风等。
	1. 舒林酸 (38194-50-2) 的生产方法: (1) 方法一 4-硝基邻苯二甲酸经氯化还原为4-氨基邻苯二甲酸, 经Schiemann反应生成4-氟邻苯二甲酸, 酯化为4-氟邻苯二甲酸乙酯, 和丙酸乙酯在钠作用下缩合环合, 生成二氢茚, 再和有机膦化合物反应, 在3位引入乙酸甲酯, 接

着和对甲亚磺酰基苄基溴进行格氏反应，最后水解得成品。

(2) 方法二

以5-氟-2-甲基-3-氧代-2,3-二氢-1H-茚为原料，先和2-氨基乙酸缩合，在3位引入乙酸后，再和对甲硫基苯甲酰缩合，最后氧化即得所要产品。

(3) 方法三

5-氟-2-甲基-1-氧代-2,3-二氢-1H-茚和对甲硫基苄基氯进行格氏反应，在1位引入对甲硫基苄基，然后在酸性中脱水，在1, 2位形成双键，再和乙醛酸反应，在3位引入乙酸基，双氧水氧化，最后酸化使双键移位得到该产品。

2. 舒林酸 (38194-50-2) 的规格：

按干燥品计算，含不少于99.0%和不大于101.0%的 $C_{20}H_{17}FO_3S$ ；在真空中于100℃加热2h，其干燥失重应不大于0.5%；炽灼残渣应不大于0.1%；重金属含量应不超过0.001%。

3. 适应症：

(1) 用于骨关节炎、类风湿关节炎、慢性关节炎、肩周炎、颈肩腕综合征、腱鞘炎等。

(2) 用于各种原因引起的疼痛，如痛经、牙痛、外伤和手术后疼痛。

(3) 还可用于轻、中度癌性疼痛。

药理：

(1) 药效学：本药结构与吲哚美辛相似，是活性极小的前体药，进入人体后代谢为硫化物。该硫化物具有抑制环氧酶，减少前列腺素合成的活性，具有消炎、镇痛、解热的作用，对环氧酶的抑制作用较本药强500倍。本药的抗炎作用为阿司匹林的16倍，吲哚美辛的2倍。镇痛作用是布洛芬的10倍，但解热作用比布洛芬弱。本药的另一个特点是对于肾脏的生理性前列腺素抑制不明显，因此对肾血流量和肾功能的影响较小，故更适用于老年人和肾血流量潜在不足者。本药对胃肠道的刺激性也较同类药小。

(2) 药动学：口服后至少88%被吸收，血药浓度达峰时间为1~2小时。约95%与血浆蛋白结合。可分布于肝、胃、肾、肠及其它部位，乳汁中的浓度为血浆浓度的10~20%。本药可代谢成有活性的硫化物和无活性的砜，硫化物和原形药之间可相互转换。原形药的半衰期为7.8小时，活性代谢物的半衰期为14小时。药物最终以原形药或无活性代谢物或葡萄糖醛酸结合物形式通过粪便及尿液排出。而活性代谢物在尿中几乎没有，只有少部分通过胆汁排出，大部分又转变成原形药。

用量用法

成人：常规剂量，口服给药。（1）抗风湿：每次0.2g，每日早晚各1次。每日剂量不超过0.4g。（2）镇痛：首次0.2g，8小时后重复。

儿童：常规剂量，口服给药2岁以上儿童：每日按体重4.5mg/kg，分2次服。每日剂量不得超过6mg/kg。

不良反应

(1) 胃肠道：胃肠道反应是最常见的不良反应，但较阿司匹林少且轻，而与布洛芬、萘普生相似。

(2) 中枢神经系统：可见头晕、头痛、嗜睡、失眠，但少见。

(3) 肾脏：本药虽可用于老年人，但服用后有出现肾病综合征的报道。

生产方法及其他：(4) 其它：极少见耳鸣、水肿、骨髓抑制、急性肾衰竭、心力衰竭、肝损害、胰腺炎、瘙痒、皮疹和Steven-Johnson综合征等。

注意事项

(1) 交叉过敏：本药可能与阿司匹林有交叉过敏反应，故对阿司匹林或其它非甾体抗炎药过敏者也可能对本药过敏，宜慎用。2. 禁忌症：对本药过敏者；活动性消化性溃疡或曾有溃疡出血或穿孔史者；孕妇及哺乳妇女；2岁以下儿童。

制剂与规格

片剂：0.1g, 0.15g, 0.2g；胶囊：0.1g。

4. 鉴别

(1) 取本品的细粉适量（约相当于本药15mg），照本药项下的鉴别（1）项试验，显相同的反应。

(2) 取含量测定项下的溶液，照分光光度法测定，在284nm与327nm的波长处有最大吸收。

检查

(1) 有关物质：照高效液相色谱法测定。

(2) 色谱条件与系统适用性试验：用硅胶为填充剂；以氯仿-醋酸乙酯-乙醇-冰醋酸（400:100:4:1）为流动相；检测波长为280nm。理论板数按该药物峰计算应不低于2000。

(3) 测定法：取本品的细粉适量（约相当于本药20mg），精密称定，加流动相10ml，溶解，滤过，取滤液作为供

试品溶液：取供试品溶液适量，加流动相定量稀释制成每1ml中含6μg的对照溶液。取对照溶液20μl注入液相色谱仪，调节检测灵敏度，使主成分峰高为满量程的25%~30%；再取供试品溶液20μl注入液相色谱仪，记录色谱图至主成分峰保留时间的2倍，量取峰面积，供试品溶液各杂质峰面积的和不得大于对照溶液的主峰面积（0.2%）。

(4) 溶出度：取本品，照溶出度测定法，以**磷酸**盐缓冲液（pH7.2）900ml为溶剂，转速为每分钟50转，依法操作，经45分钟时，取溶液10ml，滤过，精密量取续滤液适量，加上述溶剂定量稀释制成每1ml中约含10μg的溶液；另取经100℃减压干燥至恒重的该药物对照品，加上述溶剂溶解并定量制每1ml中含10μg的溶液。取上述两种溶液，照分光光度法，在326nm的波长处分别测定吸收度，按二者吸收度的比值计算出每片的溶出量。限度为标示量的80%，应符合规定。

(5) 其他：应符合片剂项下有关的各项规定。

含量测定

取本品20片，精密称定，研细，精密称取适量（约相当于本药0.1g），置100ml量瓶中，加0.1mol/L**盐酸**甲醇溶液80ml，振摇10分钟使该药溶解，并稀释至刻度，摇匀，滤过，精密量取续滤液3ml，置200ml量瓶中，用0.1mol/L盐酸甲醇溶液并稀释至刻度，摇匀，照分光光度，在327nm的波长处测定吸收度，按C₂₀H₁₇FO₃S的吸收系数（E^{1%}_{1cm}）为373计算，即得。

5. 对水是稍微有危害的不要让未稀释或大量的产品接触地下水、水道或者污水系统，若无政府许可，勿将材料排入周围环境。

6. ①疏水参数计算参考值（XlogP）：3.4；

②氢键供体数量：1；

③氢键受体数量：4；

④可旋转化学键数量：4；

⑤拓扑分子极性表面积（TPSA）：54.4；

⑥重原子数量：25。

7. 常规情况下不会分解，没有危险反应。应该密封、阴凉、干燥保存。

相关化学品信息

(R)-(+)-N-苄基-1-苯乙胺 4,4'-二氟二苯砜 38054-60-3 3,4,5-三甲氧基苯醇 1-(4-甲氧基苯基)哌嗪 氯化碘乙酸 3-甲基-2-硝基呋喃 偶氮胂II 2',3',5'-三乙酰肌苷 抗氧化剂THP-EPQ 丁二酸一甲酯 38122-80-4 钙色素 醋酸泼尼松龙环氧 三氟乙酸乙酯 氟化铬 呋咪唑 酮硫酸钠