

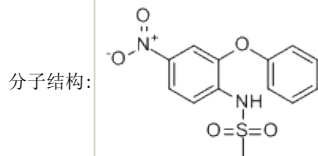


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[51803-78-2](#), 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.icchemistry.cn](#)

CAS Number:51803-78-2 基本信息

中文名:	尼美舒利; N-(4-硝基-2-苯氧基苯基)甲基磺酰胺
英文名:	Nimesulide
别名:	N-(4-nitro-2-phenoxyphenyl)-methanesulfonamide



分子式:	C ₁₃ H ₁₂ N ₂ O ₅ S
分子量:	308.31
CAS登录号:	51803-78-2
EINECS登录号:	257-431-4

物理化学性质

熔点:	140-146°C
性质描述:	<p>尼美舒利 (51803-78-2) 的性状:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1. 从乙醇得淡褐色结晶, 熔点143~144.5°C; 2. 淡黄色无定形粉末, 无臭无味; 3. 易溶于氯仿、二氯甲烷或氢氧化钠水溶液; 4. 急性毒性LD₅₀大鼠 (mg/kg): 324口服。

安全信息

安全说明:	S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。 S36: 穿戴合适的防护服装。
危险类别码:	R22: 吞咽有害。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#51803-78-2化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

Sigma-Aldrich 专业从事51803-78-2及其他化工产品的生产销售 800-736-3690
孝感深远医药化工有限公司 尼美舒利专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0712-2580635 15527768836

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. 51803-78-2](#) 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:	为非甾体抗炎药, 具有抗炎、镇痛、解热作用, 可用于慢性关节炎症(如类风湿性关节炎和骨关节炎等); 手术和急性创伤后的疼痛和炎症; 耳鼻咽喉部炎症引起的疼痛、痛经、上呼吸道感染引起的发热等症状的治疗。
	<ol style="list-style-type: none"> 1. 尼美舒利 (51803-78-2) 的规格: 含C₁₃H₁₂N₂O₅S应为98.0%~102.0%; 红外光谱应和标准品相符; 熔点应为147~151°C; 干燥失重不得大于1.0%; 含重金属不得大于0.002%; 有关物质应符合规定; 硫酸盐灰分不得大于0.20%。

2. 尼美舒利 (51803-78-2) 的生产方法:

溴化苯经硝化生成邻硝基溴化苯, 和苯酚钠进行亲核取代反应, 生成二苯醚衍生物, 经Raney镍催化氢化还原硝基为氨基, 用甲磺酰氯于85℃及有机碱存在下进行磺酰化, 最后硝化即得到 尼美舒利 (51803-78-2)。

3. (1) 作用和用途

该药在体内的抗炎作用是消炎痛的三倍, 但在体外抑制前列腺素的作用仅为消炎痛的1/5由于该药对前列腺素的抑制较弱, 它的消化道副作用较其它非甾体抗炎药小。用于多种需要抗炎治疗的疾病。具有消炎、镇痛、解热的功效, 如骨关节炎、关节外风湿病, 手术和急性创伤的疼痛和炎症, 急性上呼吸道感染引起的疼痛和发烧、痛经。

(2) 用法

成人100mg 每日二次, 饭后服用, 儿童常用剂量为5mg/公斤-体重/天, 分二至三次服用。

(3) 不良反应

该药的耐受性良好。烧心、恶心和胃痛偶有发生, 但为短暂和轻微, 很少需要中断治疗, 罕见的病例有过过敏性皮疹、眩晕的报导。

(4) 注意事项

此药与阿司匹林和其它非甾体抗炎药有交叉反应, 因此对这些药过敏病人慎用, 不主张用于孕妇哺乳期妇女。

贮藏: 密闭, 在干燥处保存。

有效期: 暂定二年。

(5) 作用机制

NIM通过高度选择性抑制炎症性前列腺素合成酶Cox-2的活性, 抑制并清除自由基, 抑制蛋白水解酶, 抑制组胺释放而达到抗炎效果。对Cox-1不产生作用, 故不影响胃内保护性前列腺素的合成, 大大减少了消化道溃疡和出血副作用, 对阿司匹林敏感的支气管哮喘患者亦安全。

(6) 药代动力学

NIM口服吸收迅速、完全、食物对其吸收度和程度均无明显影响。药物血浆蛋白结合率99%, 可以置换与之同时服用的药物, 如水杨酸、非诺贝特、甲苯磺丁脲和吡塞米等。主要分布在细胞外液, 表现分布容积0.19~0.9L/kg。NIM在肝内代谢, 主要产物为4-羟基衍生物, 尿及粪便中的代谢产物分别为给药量的80%和20%, 口服后1~2h达血浆浓度峰值, 血浆半衰期2~3h, 相对生物利用度95.0%; 有效治疗浓度持续时间为6~8h。年龄、性别对本药的体内过程影响不明显。由于在肝内代谢, 肾脏排泄, 严重肝肾功能不全者慎用。

(7) 附注

该药是同济医科大学药学院和国家医药管理局天津药物研究院同期研究开发的最新一代非甾体抗炎二类新药。国际上, 该药于1985年首次在意大利上市, 现已在全球17个国家广泛使用, 各国大量的临床验证文献指出, 本药抗炎镇痛作用广泛, 不仅能迅速缓解牙痛、月经痛、手术后疼痛等各种疼痛, 而且能有效改善盆腔炎、耳炎、喉炎等有关症状, 生物利用度高, 具有良好的胃肠道及肝、肾耐受性, 是新一代的高选择性, 强效, 安全的抗炎止痛药。

NIM对类风湿性关节炎(RA)和骨关节炎(OA)的有效率(分别为98.0%和83.0%)明显高于萘普生(分别为76.5%和75.0%); 消除耳、鼻、喉部位的炎症效果更佳(有效率92.5%, 萘普生为61.6%), 很少发现不良反应; 对外伤后炎症的消肿镇痛效果迅速。对牙科手术后的止痛作用优于甲芬那酸及安慰剂。在妇科治疗痛经是目前镇痛效果最快最好的药物之一。能消除各种病因引起的发热, 比其他同类药物作用迅速。NIM还能使发热引起的脉搏加快和动脉收缩压的升高恢复到正常状态。经国内多家临床研究证实, 本药能迅速缓解、消除OA、风湿性关节炎的疼痛及晨僵等症状, 对急性软组织损伤亦具有良好的抗炎镇痛效果。总有效率82.0%, 而双氯芬酸, 氟苯水杨酸为80.0%, 萘普生和对乙酰氨基酚分别为78.0%和75.0%, 酮洛芬和乙哌酸均为62.0%, 吡罗昔康和甲灭酸分别为59.0%和47.0%。NIM对酵母诱发的大鼠发热模型有明显的退热作用, 其退热作用与吲哚美辛, 双氯芬酸钠及吡罗昔康相似, 其50%有效剂量(ED50)比阿司匹林低200倍, 临床实验证实, 本药对炎症引起的发热症状有效率可达88.0%。根据国内外的临床资料, 本药的副作用显著低于其他NSAIDs, 主要有恶心、呕吐、腹泻、便秘、胃痛、消化不良、腹胀、厌食等, 发生率仅8.0%, 而吲哚美辛为23.0%, 吡罗昔康25.0%, 布洛芬27.0%, 萘普生、酮洛芬、氟布洛芬, 非诺洛芬、双氯芬酸均为32.0%, 酮洛芬和萘丁美酮分别高达53.0%和62.0%。用法: 本药片剂饭后服用, 成人每次100mg, bid, 可根据病情增加到每次200mg, bid, 各类患者的服药剂量按医嘱执行。

(8) 适应症

本品为非甾体抗炎药, 具有抗炎、镇痛、解热作用, 可用于慢性关节炎(如类风湿性关节炎和骨关节炎等); 手术和急性创伤后的疼痛和炎症; 耳鼻咽喉部炎症引起的疼痛; 痛经; 上呼吸道感染引起的发热等症的治疗。

生产方法及其他:

(9) 用法用量

本品依据临床实际情况采用尽可能短的疗程。口服，成人，一次0.05~0.1g，每日2次，餐后服用。儿童用药见常用剂量为5mg/kg体重/天，分2至3次服用，其它注意见（儿童用药）项。

(10) 禁忌

已知对本药或本品中任何成份过敏者。

具有对乙酰水杨酸或其它非甾体类抗炎药过敏史者（支气管痉挛、鼻炎、风疹）。

禁用于冠状动脉搭桥手术（CABG）围手术期疼痛的治疗。

对本药具有肝毒性反应病史者。

有应用非甾体抗炎药后发生胃肠道出血或穿孔病史的患者。

患有活动性消化道溃疡/出血，脑血管出血或其它活动性出血/出血性疾病者，或者既往曾复发溃疡/出血的患者。

严重凝血障碍者。

严重心衰患者。

严重肾功能损害患者。

肝功能损害患者。

(11) 注意事项

根据控制症状的需要，在最短治疗时间内使用最低有效剂量，可以使不良反应降到最低。

如果治疗无效请终止本品的治疗。

长期应用应监测肝肾心功能等检查。

罕见本品引起严重肝损伤的报道，致死性报道更为罕见。服用本品治疗期间出现肝损伤症状（如厌食、恶心、呕吐、腹痛、疲倦、尿赤）的患者及肝功能检查出现异常的患者应该被终止治疗。这些患者不应该继续服用本品。有报导显示本品短期服用后引起肝损害，其中绝大多数属于可逆性病变。

服用本品进行治疗期间必须避免同时使用已知的肝损害性药物与过量饮酒，因为任何一种因素均可能增加本品的肝损害风险。

服用本品进行治疗期间，应建议患者避免使用镇痛药物。不推荐联合应用其它非甾体类抗炎药物，包括选择性COX-2抑制剂。

胃肠道出血、溃疡和穿孔的风险可能是致命的。无论患者是否具有消化道方面的病史、伴有或不伴有预兆症状，本品在治疗期间的任何时间均有可能导致患者出现消化道出血或溃疡/穿孔。如果出现消化道出血或溃疡，应终止本品的治疗。对于伴有包括消化性溃疡史、消化道出血史、溃疡性结肠炎或克隆氏病在内的消化道疾病的患者，应谨慎使用本品。老年患者使用非甾体抗炎药出现不良反应的频率增加，尤其是胃肠道出血和穿孔，其风险可能是致命的。

对肾功能损害或心功能不全的患者应谨慎使用本品，因为本品可能导致肾功能损害。一旦发生肾功能损害，应终止本品的治疗。

由于本品可影响血小板的功能，因此对于伴有出血倾向的患者应谨慎使用。然而，本品不能作为乙酰水杨酸预防心血管事件方面的替代品。

非甾体类抗炎药可能掩盖潜在细菌感染引起的发热。

本品可能损害女性的生育能力，因此不推荐用于准备受孕的女性。对于受孕困难或正在进行不孕原因检查的女性患者，应考虑终止使用本品。

本药属非甾体抗炎药，以下内容根据美国FDA报道：

针对多种COX-2选择性或非选择性NSAIDs药物持续时间达3年的临床试验显示，本品可能引起严重心血管血栓性不良事件、心肌梗塞和中风的风险增加，其风险可能是致命的。所有的NSAIDs，包括COX-2选择性或非选择性药物，可能有相似的风险。有心血管疾病或心血管疾病危险因素的患者，其风险更大。即使既往没有心血管症状，医生和患者也应对此类事件的发生保持警惕。应告知患者严重心血管安全性的症状和/或体征以及如果发生应采取的步骤。患者应该警惕诸如胸痛、气短、无力、言语含糊等症状和体征，而且当有任何上述症状或体征发生后应该马上寻求医生帮助。

和所有非甾体抗炎药（NSAIDs）一样，本品可导致新发高血压或使已有的高血压加重，其中的任何一种都可导致心血管事件的发生率增加。服用噻嗪类或髓袢利尿剂的患者服用非甾体抗炎药（NSAIDs）时，可能会影响这些治疗的疗效。高血压病患者应慎用非甾体抗炎药（NSAIDs），包括本品。在开始本品治疗和整个治疗过程中应密切监测血压。

有高血压和/或心力衰竭（如液体潴留和水肿）病史的患者应慎用。

NSAIDs, 包括本品可引起可能致命的、严重的皮肤不良反应, 例如剥脱性皮炎、Stevens Johnson综合征 (SJS) 和中毒性表皮坏死溶解症 (TEN)。这些严重事件可在没有征兆的情况下出现。应告知患者严重皮肤反应的症状和体征, 在第一次出现皮肤皮疹或过敏反应的任何其他征象时, 应停用本品。

(12) 儿童用药

仅用于1岁以上儿童, 剂量为5mg/kg体重/天, 分2至3次服用, 最大剂量不超过100mg, 1天2次。用于退热, 疗程不超过3天。用于风湿病, 疗程应遵医嘱。

4. 该物质对环境可能有危害, 对水体应给予特别注意。遵照规定使用和储存则不会分解, 要密闭于阴凉干燥环境中。

5. 该物质的其他参数如下:

①疏水参数计算参考值 (XlogP) : 2.6;

②氢键供体数量: 1;

③氢键受体数量: 6;

④可旋转化学键数量: 4;

⑤拓扑分子极性表面积 (TPSA) : 98.5;

⑥重原子数量: 21。

相关化学品信息

[51175-78-1](#) [5196-74-7](#) [百里酚酞单磷酸二铵盐](#) [51946-06-6](#) [51076-38-1](#) [草酸亚铁](#) [51707-29-0](#) [氯代异丁烷](#) [51529-34-1](#) [双戊烯](#) [51024-05-6](#) [51751-16-7](#) [51527-63-0](#) [51786-15-3](#) [51334-85-1](#) 410