



本PDF文件由

免费提供，全部信息请点击[53714-56-0](#)，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:53714-56-0 基本信息

中文名:	亮丙瑞林
英文名:	Leuprorelin
别名:	Luteinizinghormone-releasing factor (pig), 6-D-leucine-9-(N-ethyl-L-prolinamide)-10-deglycinamide-; (D-Leu6, des-Gly-NH2)10-LH-RH ethylamide; 1: PN: WO02087616 PAGE: 31 claimed protein; A43818; D-Leu6-des-Gly10-LH-releasing hormone ethylamide; Des-Gly10-[D-Leu6]-LH-releasing hormone ethylamide; Des-Gly10-[D-Leu6]LH-RHethylamide; 1-9-Luteinizinghormone-releasing factor (swine), 6-D-leucine-9-(N-ethyl-L-prolinamide)-; Leuprorelin; Lupron SR; NSC 377526; PGlu-His-Trp-Ser-Tyr-D-Leu-Leu-Arg-Pro-NHC2H5; Leuprolide Acetate;
分子结构:	
分子式:	C ₅₉ H ₈₄ N ₁₆ O ₁₂
分子量:	1209.41
CAS登录号:	53714-56-0

安全信息

安全说明:	S22: 不要吸入粉尘。 S24/25: 防止皮肤和眼睛接触。
-------	------------------------------------

CAS#53714-56-0化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

大连美仑生物技术有限公司 专业从事53714-56-0及其他化工产品的生产销售 0411-62254483, 82593631

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. 53714-56-0](#) 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

亮丙瑞林(53714-56-0)的用途:

产品应用: 用于治疗前列腺癌、卵巢囊肿、子宫肌瘤、乳癌及小儿隐睾症等。为促性腺激素(GnRH)的九肽合成类似物,能促使垂体前叶释放黄体生成激素(LHRH)和卵泡刺激素(FSH),调节性腺激素分泌,提高睾丸酮和二氢睾丸酮的血清浓度,从而达到治疗生殖系统疾病的功能。

只需轻轻,

1. 亮丙瑞林(53714-56-0)的制备方法:

1. 苯酚和光气反应,生成氯甲酸苯酯,再和叔丁醇反应,生成叔丁氧基甲酸苯酯,接着和肼反应后,再亚硝化生成叠氮甲酸叔丁酯,然后和亮氨酸反应,得到亮氨酸侧链。

2. 同样可以得到脯氨酸侧链。

3. 丝氨酸和氯化苄反应以保护羟基,再和叠氮甲酸叔丁酯反应得到丝氨酸侧链。

4. 和丝氨酸相似,可以得到酪氨酸及组氨酸的侧链。

5. 叠氮甲酸叔丁酯和色氨酸反应后,再和2,4,6-三甲氧基苯磺酰氯反应成酯,得到色氨酸侧链。

6. 叠氮甲酸叔丁酯和精氨酸反应,再和对甲苯磺酰氯反应,得到精氨酸侧链。

7. 得到上述的侧链后,再进行接肽,然后和乙胺反应,再水解或氢解脱去保护基后,精制提纯得到利普安。

2. 规格:

按无水、无醋酸物计算,含 $C_{59}H_{84}N_{16}O_{12}$ 不得少于97.0%和不得大于103.0%; $[\alpha]^{20}_D -38.0^\circ \sim -42.0^\circ$ [1mL1%(体积)冰醋酸含10.0mg本品]; 氨基酸含量为谷氨酸0.85~1.1、脯氨酸0.85~1.1、亮氨酸1.8~2.2、酪氨酸0.85~1.1、组氨酸0.85~1.1、精氨酸0.85~1.1; 除色氨酸外,不能含其他微量的氨基酸; 有关物质应符合规定; 醋酸含量应为4.7%~9.0%; 含水分不得大于5.0%; 无菌应符合规定; 每1mg本品含不得大于16.7EU; 硫酸盐灰分不得大于0.3%。

3. 亮丙瑞林(53714-56-0)的药理毒理:

GnRH类似物。作用同布舍瑞林。重复给予大剂量的促黄体生成释放激素(LH-RH)或其高活性衍生物醋酸亮丙瑞林,在首次给药后能立即产生一过性的垂体-性腺系统兴奋作用(急性作用),然后抑制垂体生成和释放促性腺激素。它还进一步抑制卵巢和睾丸对促性腺激素的反应,从而降低雌二醇和睾丸酮的生成(慢性作用)。醋酸亮丙瑞林的促黄体生成激素(LH)释放活性约为LH-RH的100倍,它的抑制垂体-性腺系统功能的作用也强于LH-RH。醋酸亮丙瑞林是高活性的LH-RH衍生物,由于它对蛋白分解酶的抵抗力和对LH-RH受体的亲和力都比LH-RH强,所以能有效地抑制垂体-性腺系统的功能。此外,醋酸亮丙瑞林又是一种缓释制剂,它恒定地向血液中释放醋酸亮丙瑞林,故能有效地降低卵巢和睾丸的反应,产生高度有利的垂体-性腺系统的抑制作用。对子宫内膜异位症、子宫肌瘤或绝经前乳腺癌患者,每4周1次皮下注射醋酸亮丙瑞林,使血清中雌二醇下降到接近绝经期的水平。因此本品有卵巢功能抑制作用,可抑制正常排卵和使月经停止。对前列腺癌患者皮下注射醋酸亮丙瑞林,每4周1次,使血清睾丸酮浓度降至去势水平之下,表明本品有药理学的去势作用。对患有中枢性早熟的男孩和女孩每4周1次,皮下注射醋酸亮丙瑞林后,血清中促性腺激素的水平降至青春期前的水平,表明对第二性征有进行性抑制作用。

4. 适应证:

子宫内膜异位症;伴有月经过多、下腹痛、腰痛及贫血等的子宫肌瘤;绝经前乳腺癌,且雌激素受体阳性患者;前列腺癌;中枢性性早熟症。临床主要用于前列腺癌及子宫内膜异位症。

5. 用法用量:

皮下注射,成人3.75mg/次,1次/4周。 子宫内膜异位症:通常,成人每4周1次,皮下注射醋酸亮丙瑞林3.75mg。当患者体重低于50kg时,可以使用1.88mg的制剂。初次给药应从月经周期的1~5日开始。 子宫肌瘤:通常,成人每4周1次,皮下注射醋酸亮丙瑞林1.88mg。但对于体重过重或子宫明显肿大的患者,应注射3.75mg。初次给药应从月经周期的1~5日开始。 前列腺癌、绝经前乳腺癌:通常,成人每4周1次,皮下注射醋酸亮丙瑞林3.75mg。 中枢性性早熟症:通常,每4周1次,皮下注射醋酸亮丙瑞林30mg/kg,根据患者症状可增量至90mg/kg。

6. 不良反应:

内分泌系统:发热,颜面潮红,发汗,食欲减退,阳痿,男子女性化乳房,睾丸萎缩,会阴不适等现象。 肌肉骨骼系统:可见骨疼痛,肩腰四肢疼痛。 泌尿系统:可见排尿障碍,血尿等。 循环系统:可见心电图异常,心胸比例增大等。 消化系统:恶心,呕吐食欲不振等。过敏反应:可见皮疹搔痒等。 注射局部疼痛,硬结,发红。 其他:可见浮肿,胸部压迫感,发冷,疲倦,体重增加,知觉异常,听力衰退,耳鸣,头部多毛,尿酸, BUN, LDH, GOT, GPT上升等。由于雌激素降低作用而出现的更年期综合征样的精神抑郁状态。

7. 亮丙瑞林(53714-56-0)的注意事项:

对本药成份、合成的LH-RH或LH-RH衍生物有过敏史者禁用。孕妇或有可能怀孕的妇女,或哺乳期妇女;有性质不明的、异常的阴道出血者[有可能为恶性疾病]禁用。 皮下注射部位选上臂部、腹部、臀部,注射后不得揉搓注射部位。

首次用药初期，由于高活性LH-RH衍生物对垂体-性腺系统的刺激作用，使血清睾丸素浓度上升，可见骨性疼痛暂时加重，尿储留或脊髓压迫症状，应对症处理。已存在由脊髓压迫或尿储留引起的肾功能障碍者或者是有重新发作可能性的患者及高龄者慎用。治疗时一定要确认患者未妊娠，且于月经周期的1-5天开始给药，在治疗期内应采用非激素性方法避孕。给药时应留心与类似疾患(恶性肿瘤等)鉴别，如给药过程中肿瘤增大，临床症状未见改善时应中止给药。由于雌激素降低可引起骨质的损失，故需长期给药或再次给药时，应尽可能检查骨密度，慎重用药。 对含有明胶的药物或含有明胶的食物有过敏史者，例如休克、过敏性症状(荨麻疹、呼吸困难、口唇浮肿、喉头水肿等)应慎重用药；已有因使用本品引起血栓形成及肺栓塞症的报告。

8. 孕妇及哺乳用药：

孕妇以及可能怀孕的妇女或哺乳妇女不应给予醋酸亮丙瑞林。

9. 儿童用药：

醋酸亮丙瑞林对早产儿，新生儿和乳儿的安全性尚未确定。

只需轻轻，

相关化学品信息

5336-03-8 N-苄基哌嗪二盐酸盐 麦斯明 53262-00-3 3-氯-5-羟基苯甲酸 5358-71-4 5378-52-9 5396-47-4 (E,Z)-2-己烯酸-3-己烯
酯 纽莫康定A0 53585-93-6 53823-15-7 53109-90-3 二碘-4-硝基苯胺 53605-15-5 聚乙二醇酯 碳酸镁 六水氯化钪 488