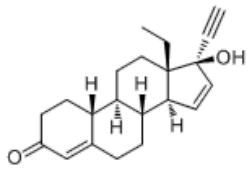




本PDF文件由 [www.ichemistry.cn](http://www.ichemistry.cn) 免费提供, 全部信息请点击[60282-87-3](http://60282-87-3), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](http://CAS号查询网)

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](http://www.ichemistry.cn)

#### CAS Number: 60282-87-3 基本信息

中文名:	孕二烯酮; 17 $\alpha$ -乙炔-13-乙基-17 $\beta$ -羟基-4,15-雌烯-3-酮
英文名:	Gestodene
别名:	17-(2-Propenyl)estr-4-en-17-ol; (17 $\alpha$ )-13-Ethyl-17-hydroxy-18,19-dinorpregna-4,15-dien-20-yn-3-one
分子结构:	
分子式:	C <sub>21</sub> H <sub>26</sub> O <sub>2</sub>
分子量:	310.43
CAS登录号:	60282-87-3
EINECS登录号:	262-145-8

#### CAS#60282-87-3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60282-87-3及其他化工产品的生产销售 0411-82593631、82593920

将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 孕二烯酮专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 021-61552785

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. 60282-87-3](http://CAS.No.60282-87-3) 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:	孕二烯酮(60282-87-3)的用途: 孕激素, 作用比其它19去甲甾酮衍生物强, 在有效剂量内几无雄激素作用。 和乙炔雌二醇组成新的复方口服避孕药。
生产方法及其他:	孕二烯酮(60282-87-3)的生产方法: 以18-甲基雌甾-4-烯-3, 17-二酮为原料。在20L玻璃发酵罐, 装有15L无菌溶液。该溶液的组成如下: 3%葡萄糖, 1%玉米粉, 0.2%硝酸钠, 0.1%磷酸二氢钾, 0.2%磷酸氢二钾, 0.05%硫酸镁, 0.002%硫酸亚铁(II)和0.05%氯化钾。植入250ml在振荡瓶中培养了72h的青霉菌, 在30℃、搅拌和鼓入空气下培养24h。在无菌条件下, 将1.8L该培养液移入装有30L和上述无菌溶液相同组成的溶液的50L发酵罐中。培养12h后, 加入120g吐温-80盐的18-甲基雌甾-4-烯-3, 17-二酮悬浮于2L蒸馏水的溶液, 在相同条件下再培养70h。然后用甲基异丁酮提取, 提取液真空浓缩至于。剩余物用活性炭作用后, 以乙酸乙酯重结晶, 得97.8g化合物(I), 收率77.2%, 熔点179.9℃。  250g(827mmol)化合物(I)溶于704ml吡啶, 在0℃和10min中, 滴加77.5ml甲磺酰氯, 反应3.5h。加入350ml二甲基甲酰胺和283g无水乙酸钠, 在氩气气氛下, 于室温搅拌20h。反应液倾入冰水中, 过滤收集析出的沉淀, 用水洗, 真空干燥。将得到的212g粗品溶于1500ml乙酸乙酯和0.4ml吡啶, 加入21.0g活性炭脱色。浓缩至420mL, 0℃放置结晶。过滤得188g化合物(II), 收率80%, 熔点156.9℃(从丙酮-己烷重结晶)。  往240ml四氢呋喃和60ml己烷的混合液中, 在-70℃通入乙炔15min。在氩气保护下, 滴加

180ml (288mmol) 15% [正丁基锂](#) (己烷溶液) 在180ml四氢呋喃的溶液。10min后, 加入30.0g (106mmol) 化合物(II) 在210ml四氢呋喃的溶液。在-70℃和搅拌下, 继续通入乙炔1h。加入150ml [甲醇](#)和45ml浓 [盐酸](#), 在室温搅拌1h后, 再加入375ml水。真空浓缩后, 在0℃放置结晶。过滤, 水洗, 干燥。用0~50% [乙酸乙酯](#)/己烷层析, 并用 [乙酸乙酯](#) 重结晶, 得18.4g孕二烯酮, 收率56%, 熔点198℃。

同样以18-甲基雌甾-4-烯-3, 17-二酮为原料, 100g (330mmol) 化合物(I) 溶于350ml吡啶, 滴加200ml [乙酸酐](#)。加毕再反应1h。反应液倾入冰水, 过滤收集析出的沉淀, 水洗至中性, 50℃真空干燥, 得109.3g化合物(III), 收率96%。以丙酮-己烷重结晶后, 熔点165.5℃。

48.0g (139mmol) 化合物(III) 和4.8g [对甲苯磺酸](#)吡啶盐溶于400ml 2, 2-二甲氧基丙烷, 回流搅拌6h。缓慢冷至-20℃。4h后, 过滤收集结晶, 用小量冷甲醇洗数次, 真空干燥, 得42.0g化合物(IV), 收率84%。以丙酮-己烷重结晶后, 熔点194℃。

往200ml (320mmol) [正丁基锂](#) (15%的己烷溶液) 在400ml无水四氢呋喃的溶液中, 在0℃通乙炔30min。把如此得到的乙炔锂溶液, 在0℃及氩气保护下, 滴加到20.0g (56mmol) 化合物(IV) 在500ml无水四氢呋喃的溶液。缓慢加入80ml半浓的盐酸, 0℃搅拌10min。用 [乙酸乙酯](#) 提取, 提取液水洗, 干燥, 活性炭脱色。用约. 50ml [甲醇](#) 重结晶, 得13.0g孕烯二酮, 收率. 75%, 熔点197℃。

对化合物(I) 中3位的羰基用缩酮或 [硫](#) 缩酮, 和乙炔锂或乙炔溴化 [镁](#) 反应引入乙炔后, 再脱去缩酮得孕二烯酮。

18-甲基雌甾-4-烯-3, 17-二酮经选择性氧化在15位引入羟基; 和2, 2-二甲基 [丙二醇](#) 反应, 在3位形成缩酮而对其进行保护; 和三甲基氯化 [硅](#) 或乙酸酐反应, 在15位形成三甲硅氧基或乙酰氧基; 接着和乙炔溴化 [镁](#) 反应, 在17位引入乙炔基, 再在草酸作用下水解脱水, 得到孕二烯酮。

也可先脱水形成烯键, 再引入乙炔基。7.5g [镁](#) 和24ml [溴乙烷](#) 在140ml四氢呋喃中反应, 得乙基溴化 [镁](#)。再加入300ml四氢呋喃, 在冰浴冷却下, 向反应液中通入约40min的乙炔。滴加5g 18-甲基-3, 3-(2, 2-二甲基-1, 3-丙亚基二氧)-5, 15-和-5(10), 15-雌甾二烯-17-酮溶于200ml四氢呋喃的溶液。加毕, 在室温下搅拌2h。小心加入氯化铵溶液, 并用 [乙醚](#) 稀释。分出的有机层不断地用水洗, 再 [无水硫酸钠](#) 干燥, 减压浓缩至于。用硅胶及2.5%~2.9% 丙酮/己烷进行层析, 得3.1g 17 $\alpha$ -乙炔基-18-甲基-3, 3-(2, 2-二甲基-1, 3-丙亚基二氧)-5, 15-和-5(10), 15-雌甾二烯-17 $\beta$ -醇。该化合物和70ml [甲醇](#)、14ml水及2.3g草酸一起剧烈搅拌40min。反应液用 [乙醚](#) 稀释后, 水洗至中性, 干燥。用丙酮-己烷重结晶, 得1.4g孕二烯酮, 熔点154℃。

#### 孕二烯酮(60282-87-3)的药理及应用:

为迄今孕激素作用最强而使用剂量最低的一种避孕药。其孕激素活性为左旋甲炔诺酮的2倍, 并无雄激素和雌激素活性, 有抗雌激素作用。口服吸收迅速而完全, 经1~2小时血浓度达峰值, 生物利用度100%, 消除 $t_{1/2}$ 8小时。临床与炔雌醇组成复合片或三相片用作短效口服避孕药。由于其避孕效果可靠、周期控制好, 对脂代谢能产生有利影响, 提高hdl, 故为目前最为理想的一种口服避孕药。

#### 孕二烯酮(60282-87-3)的用法:

口服: 从月经周期第1天开始, 每天1片, 连服21天。三相片, 每6天、5天和10天依次服用不同含量的药片, 每天1片。

#### 孕二烯酮(60282-87-3)的注意:

可有恶心、呕吐、头痛、体重增加、乳房胀等。有血栓史、心、肾、肝病患者及孕妇、哺乳妇禁用。

#### 孕二烯酮(60282-87-3)的药物相互作用:

巴比妥类、[苯妥英钠](#)、扑米酮、卡马西平、利福平、灰黄霉素等不能同时使用。

孕二烯酮(60282-87-3)的制剂:

片剂: 每片含孕二烯酮0.075mg和炔雌醇0.03mg或0.02mg。

三相片: 开始6天, 每片含孕二烯酮0.05mg、炔雌醇0.03mg, 其后5天和10天相应每片合药0.07mg、0.04mg和0.1mg、0.03mg。

相关化学品信息

[60864-62-2](#) [5-氟-2-\(甲硫基\)嘧啶](#) [60249-26-5](#) [6034-68-0](#) [608-44-6](#) [香豆灵酸甲酯](#) [609-32-5](#) [60019-19-4](#) [3-乙](#)  
[氧基-4-甲氧基苯腈](#) [607-58-9](#) [60940-24-1](#) [6086-19-7](#) [3,4,6-三氯哒嗪](#) [60058-39-1](#) [60991-01-7](#) 421

生成时间2021/1/28 2:54:49