



本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[62613-82-5](#), 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](#)

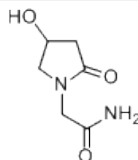
## CAS Number:62613-82-5 基本信息

中文名: 奥拉西坦;  
4-羟基-2-氧代吡咯烷-N-乙酰胺

英文名: Oxiracetam

别名: 4-Hydroxy-2-oxopyrrolidine-N-acetamide

分子结构:

分子式:  $C_6H_{10}N_2O_3$ 

分子量: 158.16

CAS登录号: 62613-82-5

## 物理化学性质

熔点: 165-168°C

密度: 1.416

## 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。

危险品标:



Xi: 刺激性物质

危险类别码: R36/38: 对眼睛和皮肤有刺激作用。

CAS#62613-82-5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. 62613-82-5 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: 奥拉西坦(62613-82-5)的用途:  
该药为吡拉西坦的衍生物, 有中枢兴奋作用, 能促进脑代谢, 显著提高和促进大脑记忆, 对老年性记忆和精神衰退有效。  
本品服后大部分以原型药自尿排泄, 在体内不积蓄, 吸收良好, 耐受性良好。用于老年人大脑功能不全、记忆力减退, 尤适用于老年性痴呆症, 还可用于神经官能症、脑外伤、脑炎等脑部疾病的康复期治疗等。

1. 奥拉西坦(62613-82-5)的生产方法:

(1) 方法一:

4-氨基-3-羟基丁酸和二(三甲基硅烷基)胺反应, 对羟基进行保护, 然后内酰胺化生成内酰胺, 以2-溴乙酸乙酯对氨基进行烷基化, 生成2-氧代-4-三甲硅氧基-1-吡咯烷乙酸乙酯, 水解脱去羟基上的保护基, 再氨解得到奥拉西坦(62613-82-5)。

(2) 方法二:

①648g亚胺二乙酸乙酯溶于3600mL无水二氯甲烷和572mL三乙胺中,在0℃和搅拌下,滴加619g2-乙酯基乙酰氯溶于1100mL二氯甲烷中的溶液。在滴加过程中,注意反应温度不要超过10~15℃。加毕,在室温下搅拌2h后,放置过夜。然后水洗,干燥,减压浓缩。得到的油状的N-(2-乙酯基乙酰基)亚胺二乙酸乙酯溶于无水苯中,然后在室温下,把该苯溶液加到75.6g钠溶于2700mL无水乙醇的溶液。回流6h,冷却至室温。用水不断地萃取反应液,萃取液合并,用盐酸酸化至pH值为1。过滤析出的沉淀,重结晶得2-(3-乙酯基-4-羟基- $\Delta^3$ -吡咯烷-2-酮-1-基)乙酸乙酯,熔点175~179℃。

②将20g2-(3-乙酯基-4-羟基- $\Delta^3$ -吡咯烷-2-酮-1-基)乙酸乙酯加入200mL热乙腈和1.8mL水中。回流20min后,用冰浴冷却,减压浓缩得2-(吡咯烷-2,4-二酮-1-基)乙酸乙酯,熔点87~91℃。

③将22.25g2-(吡咯烷2,4-二酮-1-基)乙酸乙酯溶于445mL无水二甲氧基乙烷中,冷至0℃,加入1.52g硼氢化钠,在冰浴上放置10min后,再在室温下放置30min。用20%盐酸酸化,过滤,滤液减压浓缩后,溶于二氯甲烷,用无水硫酸镁干燥。过滤,减压浓缩,层析后得2-(4-羟基吡咯烷-2-酮-1-基)乙酸乙酯,熔点180℃(分解)。

④8.9g2-(4-羟基吡咯烷-2-酮-1-基)乙酸乙酯溶于300mL甲醇,在0℃时通入氨气,然后放置过夜。减压除去溶剂,剩余物溶于甲醇,用活性炭过滤。将滤液缓慢加到200mL异丙醚中,收集析出的沉淀,即为奥拉西坦(62613-82-5),熔点161~163℃。

## 2. 功能主治:

适用于脑功能不全、记忆力障碍及老年性痴呆等的治疗。

## 3. 用法及用量:

口服:每次800mg,每日2次,重症每日2-8g。静注或肌注:每次1g。

## 4. 不良反应和注意:

据国外文献报道,该药的不良反应少见,偶见皮肤瘙痒、恶心、神经兴奋、头晕、头痛、睡眠紊乱,但症状较轻,停药后可自行恢复。

## 5. 规格:

片剂:0.4g;针剂:1g/5ml。

## 6. 药理作用:

本品为脑代谢改善药,属于 $\alpha$ -氨基丁酸的环形衍生物。有抗物理因素,化学因素所致的脑功能损伤似的作用。能促进脑内ATP,可促进乙酰胆碱合成并正增强神经兴奋的传导,具有促进脑内代谢作用。可以对抗由物理因素、化学因素所致的脑功能损伤。对缺氧所致的逆行性健忘有改进作用。可以增强记忆,提高学习能力。

小鼠跳台试验、避暗试验和水迷宫试验等3种学习记忆试验及大鼠主动回避条件反射试验,均证明该药对化学物质所致的学习记忆障碍有显著的改善作用和学习记忆促进作用。

## 生产方法及其他: 7. 适应症:

本品为促智药,临床用于老年性痴呆,多梗塞痴呆及神经官能症、脑外伤、脑炎等症引起的大脑功能不全、记忆力障碍,特别是对防治老年性痴呆,疗效显著。

## 8. 临床评价:

北京医科大学对该药进行I期临床试验,正常受试者22例,一次口服不同剂量(200,400,800,1200,1600和2000mg)该药后,对神经系统、体温、心血管系统、呼吸系统以及对肝、肾、血液系统均无明显影响( $P>0.05$ ),所以该药是一种耐受性好的低毒药物。

## 9. 标准号:

WS-347(X-299)-96。

## 10. 活性成份:

含双氟芬酸钠( $C_{14}H_{10}Cl_2N_3O_2$ )应为标示量的90.0~110.0%。

## 11. 鉴别:

(1)取含量测定项下的溶液,照分光光度法测定,在276nm的波长处有最大吸收。

(2)取本品的细粉适量(约相当于双氯芬酸钠0.5g),加乙醇20ml,振摇使双氯芬酸钠溶解,滤过,滤液置水浴上蒸干,取残渣约50mg,加碳酸钠0.2g,混匀,加热至炭化,放冷,加水5ml,煮沸,滤过,滤液显氯化物的鉴别反应。

(3)取(2)项下的残渣灼烧后,显钠盐的鉴别反应。

## 12. 检查:

释放度取本品,照释放度测定法,采用溶出度测定法第一法的装置,以磷酸盐缓冲液(PH6.8)900ml为溶剂,转速为每分钟100转,依法操作,但在2、6与12小时分别取溶液10ml,滤过,并即时在操作容器中补充上述溶剂10ml;分别精密量取滤液5ml,置25ml量瓶中,各加上述溶剂稀释至刻度,摇匀;照分光光度法,在276nm的波长处

分别测定吸收度；另精密称取经105℃干燥至恒重的双氯芬酸钠对照品适量加上述溶剂溶解并定量稀释制成每1ml中约含20ug的溶液，同法测定吸收度，分别计算出每片在不同时间的释放量。

本品每片在2、6和12小时的释放量应分别为标示量的20～40%、40～60%和55%以上。均应符合规定。如6片中仅有1～2片超出上述规定限度，且其平均释药量均符合规定时，应另取6片复试；初复试的12片中仅有1～2片超出规定限度，且其平均释药量均符合规定时，亦可判为符合规定。其他应符合片剂项下有关的各项规定。

13. 含量测定：

取本品20片，精密称定，研细，精密称取适量(约相当于双氯芬酸钠50mg)，置100ml量瓶中，加0.002mol/L[氢氧化钠](#)溶液适量，振摇使双氯芬酸钠溶解，并稀释至刻度，摇匀，滤过，弃去初滤液，精密量取续滤液2ml，置100ml量瓶中，加上述溶剂稀释至刻度，摇匀，照分光光度法，在276nm的波长处测定吸收度；另取经105℃干燥至恒重的双氯芬酸钠对照品适量，加上述溶剂，溶解并稀释成每1ml中约含10ug的溶液，同法测定吸收度，计算，即得。

14. 储藏：

遮光，密闭，在干燥处保存。

15. 有效期：

暂定二年。

相关化学品信息

[甲基乙基硫醚](#) [3-\(4-氯苯甲酰\)丙烯酸](#) [6261-40-1](#) [4-丙基苯乙炔](#) [6252-98-8](#) [620612-15-9](#) [62792-06-7](#) [3-\(N-甲基正戊胺基\)丙酸盐](#)  
[盐](#) [6299-30-5](#) [6289-26-5](#) [6283-33-6](#) [5-溴吡啶-3-磺酸](#) [叔丁基二甲基氯硅烷](#) [\(1-甲基乙烯基\)-苯与2-甲基-2-丁烯和1,3戊二烯的聚合](#)  
[物](#) [6275-84-9](#) [二茂铁](#) [邻硝基苯酚钠](#) [三苯基磷](#) 509