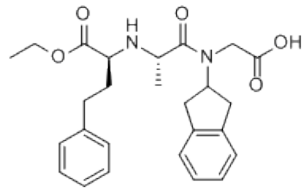




本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击83435-66-9, 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](http://www.icchemistry.cn)

CAS Number:83435-66-9 基本信息

中文名:	地拉普利; 地拉普利; N-[N-[(S)-1-(乙氧基羰基)-3-苯丙基]-L-丙氨酰]-N-(茚满-2-基)甘氨酸
英文名:	Glycine, N-[(1S)-1-(ethoxycarbonyl)-3-phenylpropyl]-L-alanyl-N-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yl)-
别名:	Glycine, N-(2,3-dihydro-1H-inden-2-yl)-N-[N-[1-(ethoxycarbonyl)-3-phenylpropyl]-L-alanyl]-, (S)-; Alindapril; Delapril; Indalapril
分子结构:	
分子式:	C ₂₆ H ₃₂ N ₂ O ₅
分子量:	452.54
CAS登录号:	83435-66-9

物理化学性质

性质描述:	地拉普利(83435-66-9)的化学性质: 盐酸 地拉普利从 丙酮-盐酸 得无色片状结晶。 熔点166~170°C(分解)。 [α] _D ²² +18.5(C=1, 甲醇)。
-------	--

CAS#83435-66-9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. 83435-66-9 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:	地拉普利(83435-66-9)的用途: 血管紧张素转化酶抑制剂, 对ACE的阻断活性是卡托普利的10倍, 对血浆中的ACE有良好的阻断作用, 持续时间长。 用于原发性高血压、肾性高血压、肾血管性高血压。
-------	--

地拉普利(83435-66-9)的生产方法:

2-茚满酮(40g)、78g甘氨酸叔丁酯·H₃PO₃络合物水和300ml甲醇混合, 在水浴和搅拌下, 于15min内分批加入23g NaBH₃CN。加毕再搅拌4h。加入400ml 20%磷酸和200ml水稀释后, 用500ml氯仿提取。提取液用无水硫酸钠干燥, 减压浓缩。剩余的油状物用乙醇-水结晶, 得47%无色棱状结晶的化合物(I), 收率63%, 熔点54~55°C。

21.8g N-苄氧羰基-L-丙氨酸和12.8ml三乙胺溶于200ml四氢呋喃, 在-15°C和搅拌下, 滴入8.5g氯甲酸乙酯。加毕, 再搅拌15min。再在-10°C以下, 滴加22g化合物(I)在100ml氯仿。加毕, 在室温下继续搅拌1h。将反应液倾入500ml水。分出的有机层减压浓缩, 剩余液溶于300ml乙酸乙酯, 依次用1mol/L氢氧化钠(2×50ml)、50ml水、20%磷酸(2×50ml)和50ml水洗, 无水硫酸镁干燥。减压浓缩得35g无色油状的化合物(II), 收率87%。

生产方法及其他:

35g化合物(II)和7g草酸溶于300ml甲醇,在10%钯-炭(50%湿体积,8.5g)催化下常压还原。滤去催化剂,滤液减压浓缩后加入500ml乙醚。过滤收集析出的无色结晶,得21.8g化合物(III),收率68%,熔点138~141℃, $[\alpha]_D^{22}+20.4^\circ$ (C=1, 甲醇)。

21g化合物(III)、4.1g乙酸钠、10ml乙酸、25g 2-氧-4-苯基丁酸乙酯、25g3A分子筛和200ml乙醇混合,在30g Raney Ni的催化下,常压加氢。当氢吸收停止后。分出上层溶液,催化剂用乙醇洗。洗液和上层溶液合并,减压浓缩。剩余物溶于500ml乙酸乙酯,用碳酸氢钠溶液和水洗,无水硫酸镁干燥。减压浓缩得淡黄色液体,用硅胶层析,丙酮-苯(1:9)洗脱。收集洗脱出的第二组分,得16.5g化合物(IV),收率61%, $[\alpha]_D^{22}-12.6^\circ$ (C=1, 甲醇)。

5g化合物(IV)溶于5ml乙酸,加入20ml 25%溴化氢-乙酸溶液,搅拌10min后,加入300ml乙醚稀释。过滤收集析出的无色结晶,得5g氢溴酸地拉普利,收率95%,熔点180~183℃, $[\alpha]_D^{22}+15.6^\circ$ (C=1.4, 甲醇)。

在搅拌下,将16.2g氢溴酸地拉普利加入500ml乙酸乙酯、33g碳酸氢钠和500ml水所成的溶液。用1mol/L盐酸酸化至Ph=4后,分出乙酸乙酯层,用水洗,无水硫酸镁干燥。然后加入20ml 7mol/L氯化氢-乙酸乙酯溶液,所成溶液减压浓缩。剩余物加入250ml乙醚和250ml石油醚使产生盐酸地拉普利沉淀(11g,收率74%),用丙酮-1mol/L盐酸重结晶,得无色片状结晶的盐酸地拉普利,熔点166~170℃(分解), $[\alpha]_D^{22}+18.5^\circ$ (C=1, 甲醇)。

上面得到的化合物(I)也可以直接和化合物(V)进行缩合,得到化合物(IV),然后再水解,成盐,得盐酸地拉普利。化合物(V)的制备可参照其它血管紧张素转化酶抑制剂的制法。化合物(I)和化合物(V)的缩合进行如下。

0.2g化合物(V)和0.22g化合物(I)溶于。10ml二甲基甲酰胺,在搅拌下滴加0.2gDEPC在5ml二甲基甲酰胺中的溶液。加毕,再加入0.15g三乙胺在1ml二甲基甲酰胺中的溶液,搅拌1h。用100ml水稀释后,用300ml乙酸乙酯提取。提取液依次用10%磷酸(2×50ml)、20ml 1mol/L氢氧化钠和水洗,无水硫酸镁干燥。减压浓缩后的油状剩余物用硅胶层析,己烷-乙酸乙酯(2:1~1:1)洗脱。得0.22g无色油状的化合物(IV),收率68%, $[\alpha]_D^{22}-12.5^\circ$ (c=0.9, 甲醇)。

相关化学品信息

[83967-03-7](#) [83711-45-9](#) [832-72-4](#) [83732-82-5](#) [83138-86-7](#) [83855-86-1](#) [832741-25-0](#) [83908-32-1](#) [83864-78-2](#) [83682-42-2](#) [1-\(4-甲基苯基\)-1-环丙甲酸](#) [83817-73-6](#) [83249-68-7](#) [83337-75-1](#) [83682-54-6](#) [沙丁胺醇](#) [二氧化锆](#) [氢气](#) 506