

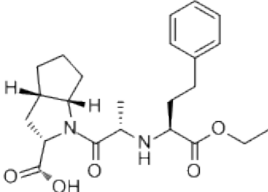


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[87333-19-5](#), 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.icchemistry.cn](#)

CAS Number:87333-19-5 基本信息

中文名:	雷米普利; N-[1(S)-乙氧羰基-3-苯丙基]-(S)-丙氨酰基-顺桥-2-氮杂二环[3,3,0]辛烷-3(S)-羧酸
英文名:	Ramipril
别名:	(2S, 3aS, 6aS)-1((S)-N-(S)-1-Carboxy-3-phenylpropyl)alanyl)octahydrocyclopenta(b)pyrrole-2-carboxylic acid 1-ethyl ester
分子结构:	
分子式:	C ₂₃ H ₃₂ N ₂ O ₅
分子量:	416.51
CAS登录号:	87333-19-5

物理化学性质


性质描述: 白色或类白色结晶性粉末。熔点107.0-110.0℃。

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。
S37/39: 使用合适的手套和防护眼镜或者面罩。

危险类别码: R36/38: 对眼睛和皮肤有刺激作用。

CAS#87333-19-5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**87333-19-5**及其他化工产品的生产销售 800-736-3690
大连美仑生物技术有限公司 雷米普利专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0411-82593631、82593920
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. 87333-19-5](#) 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: 降血压药, 用于高血压、充血性心力衰竭。

雷米普利(87333-19-5)的生产方法:

130g L-丙氨酸苄酯的对甲苯磺酸盐在2.7L 2mol/L氢氧化钠和2.7 L-二氯甲烷的溶液进行分配。分出的有机层用无水硫酸钠干燥后, 减压蒸去溶剂。剩余的油状物为L-丙氨酸苄酯[化合物(II)], 将其溶于700ml乙醇待用。另外将51g 3-苯甲酰基丙烯酸乙酯[化合物(I)]和7g 三乙胺溶于1.9L乙醇, 缓慢加入上面得到的化合物(I)的乙醇溶液。在室温搅拌至少2h, 然后冷至0℃。过滤收集结晶, 用冷乙醇和石油醚洗, 得一份产品。将滤液浓缩后, 在50℃下加热1h, 再冷至0℃, 过滤结晶, 可得另一份产品。合计得到的化合物(III)的收率为76%, 熔点74℃, $[\alpha]_D^{20}$ -17.8° (C=1, 甲醇)。

20g化合物(III)溶于200ml冰乙酸, 加入10%钨-炭催化剂, 在室温和4MPa的氢压下氢化7h。过滤, 滤液浓缩, 剩余物溶于小量乙酸乙酯, 并用环己烷重结晶, 得化合物(IV), 收率90%, 熔点148~150℃, $[\alpha]_D^{20}$ +28.2° (C=1, 甲

醇)。

在氮气保持下,将269g 3-氯-2-乙酰氨基丙酸甲酯和257g新蒸馏过的环戊烯基四氢吡咯溶于1.5 L二甲基甲酰胺。在氮气保护下室温反应24h后,减压蒸去溶剂。剩余物溶于少量水,用浓盐酸调pH值至2。用4L乙酸乙酯提取2次,提取液合并后浓缩,得到淡黄色的油状物,即化合物(V),产量290g。

270g化合物(V)在1.5L 2mol/L盐酸中回流1h。蒸去水,加入乙酸作溶剂,在5g 10%钯-炭催化下,于0.5MPa的氢压下氢化。过滤,浓缩,剩余物用氯仿-异丙醚重结晶,得消旋的化合物(VI),产量190g。

166g消旋的化合物(VII)溶于250ml 10%氢氧化钠水溶液,用500ml和100ml二氯甲烷提取游离出的碱。提取液合并后,减压浓缩。剩余物油状物溶于100ml乙酸乙酯,加入117g N-苄氧羰基-L-苯丙氨酸溶于200ml乙酸乙酯和1.6L环己烷的溶液。析出的沉淀为133g,均为S-构型的化合物(VII)的游离碱和N-苄氧羰基-L-苯丙氨酸所成的盐,熔点103~104℃, $[\alpha]_D^{27} -6.1^\circ$ (C=1, 甲醇)。将该盐溶于600ml二氯甲烷,加入9.5g氢氧化钠溶于300ml水的溶液进行处理。分出有机层,无水硫酸钠干燥后,浓缩至200ml。加入200ml异丙醚和50ml 6mol/L氯化氢的乙醚溶液,收集沉淀,即为光学活性的化合物(VII),产量67.8g,熔点180~182℃, $[\alpha]_D^{30} -38.4^\circ$ (C=1, 水)。

56.4g光学活性的化合物(VII)和59g化合物(IV)溶于300ml水和200ml二氯甲烷,在剧烈搅拌下加入140g碳酸钾溶于300ml水的溶液,并同时加入150ml磷酸单甲单乙酯,使反应液的pH值维持在9~10。反应2~3h后,用层析检测化合物(VII)有无消失,如必要可再加些试剂和无机碱。反应完全后,加入500ml二氯甲烷。分出有机层,用200ml 5%硫酸氢钾和10%硫酸钾所成的水溶液提取,然后再用200ml 5%碳酸氢钠/碳酸钠水溶液提取。提取液废弃,二氯甲烷层干燥后减压浓缩,得无色的油状物,为化合物(VIII),收率85%~95%。

生产方法及其他:

上面得到的所有的化合物(VIII)溶于500ml甲醇,加入2g 10%钯-炭催化剂,在室温和0.1~0.5MPa的氢压下,氢化30min。过滤去催化剂后,滤液减压浓缩。剩余物黏稠油状物溶于1L乙醚,接入雷米普利晶种,可得针状的雷米普利结晶,熔点109℃, $[\alpha]_D^{24} +33.2^\circ$ (C=1, 0.1 mol/L氯化氢的乙醇溶液)。

雷米普利(87333-19-5)的适应症:

高血压。充血性心力衰竭。急性心梗发作后的前几天之内出现的充血性心力衰竭。

雷米普利(87333-19-5)的用法和用量:

不管什么时候就餐,足量液体吞服即可。依适应症和剂量的不同,指定的每日剂量可在早晨一次完全服用或分成两次(早晚各一次)服用。

加服利尿剂可增强雷米普利片的降压效果。

对急性心肌梗死后出现心衰的患者,不得早于梗死后2日内开始服用雷米普利片,但也不应迟于梗死后10天才开始服用。另外建议给予雷米普利片至少15个月。

雷米普利(87333-19-5)的注意事项:

在雷米普利片治疗初期可能会引起血压过度降低,尤其是患者伴有盐和/或体液流失(如呕吐/腹泻,利尿治疗),心衰-尤其是心肌梗死后-或严重高血压。

如果可能,开始用雷米普利片治疗前,应纠正盐和/或体液流失,减少或停用现正使用的利尿剂(在心衰患者,必须权衡容量负荷过重的风险)。

这些患者的治疗应当以最低单剂量开始,早晨服用1.25mg雷米普利。

首剂后,每当雷米普利片和/或利尿剂剂量增加时,这些病人应给予医疗监护至少8小时,以免发生难以控制的低血压反应。

患有恶性高血压或心衰的患者-尤其是急性心肌梗死后-用雷米普利片治疗时应住院。

雷米普利(87333-19-5)的禁忌症:

对雷米普利及其赋形剂过敏的患者,有血管神经性水肿病史的患者,双侧肾动脉狭窄或单肾且伴肾动脉狭窄患者,血流减低性左心室流入流出障碍患者,低血压或循环状况不稳定的患者,使用高流量膜透析的患者,使用硫酸葡聚糖进行分离性输血的患者,妊娠及哺乳妇女。

相关化学品信息

[雷米普利](#) [879125-82-3](#) [879896-43-2](#) [2-仲十六烷基-5-甲基-1,4-苯二酚](#) [879125-40-3](#) [\(-\)-白玉兰亭 B](#) [青霉素V](#) [878630-96-7](#) [87976-86-1](#) [876891-23-5](#) [873962-83-5](#) [871125-69-8](#) [87605-93-4](#) [87674-14-4](#) [878572-03-3](#) [正丁基锂](#) [焦硫酸钾](#) [碘酸钠](#) 510