



本PDF文件由 爱化学 iChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[91374-21-9](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

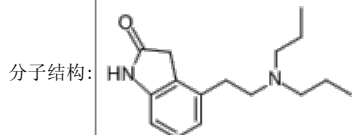
如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](#)

CAS Number:91374-21-9 基本信息

中文名: 罗匹尼罗;
4-[2-(二丙氨基)乙基]-1,3-二氢吲哚-2-酮

英文名: Ropinirole

别名: 4-(2-Dipropylaminoethyl)-1,3-dihydroindol-2-one



分子式: $C_{16}H_{24}N_2O$

分子量: 260.37

CAS登录号: 91374-21-9

物理化学性质

熔点: 243-250°C

性质描述: 熔点243-250°C

CAS#91374-21-9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. 91374-21-9 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: **罗匹尼罗(91374-21-9)的用途:**
该药是多巴胺 D_2 激动剂。用于治疗帕金森病。

1. 罗匹尼罗(91374-21-9)的生产方法:

7-羟基-4-[2-(二丙氨基)乙基]-2-(3H)-吲哚-1-酮盐酸盐和5-氯吡啶衍生物反应成醚, 生成物在钯-碳催化下加氢, 得到产物罗匹尼罗(91374-21-9)。

2. 临床应用:

- (1)用于帕金森病进展期, 可缓解运动波动障碍。
- (2)用于帕金森病早期(单用或合用司来吉兰), 可推迟使用左旋多巴的时间。

3. 药理:

药效学该药是一种选择性 D_2 受体激动药, 是非麦角林(nonergoline)、非酚类的吲哚酮衍生物。本药能与三种亚型的 D_2 受体(D_{2A} 、 D_{2B} 、 D_{2C})结合, 同时具有中枢与外周的 D_2 激动药活性。动物经口给药, 其中枢作用无明显耐受性, 降压作用(与外周 D_2 活性有关)即可产生明显耐受性。

药动学口服本药治疗帕金森病的起效时间为30-40分钟, 血药浓度达峰时间为1~2小时, 单次给药作用持续时间为16小时。片剂的生物利用度为55%。本药总蛋白结合率为10%~40%。分布容积为7.5L/kg。在肝脏代谢, 通过N-脱丙基作用和羟基形成无活性的代谢产物, 经肾排泄。总体清除率为47L/h, 母体化合物的消除半衰期为6小时。本药经血液透析清除的可能性小。

4. 注意事项:

- (1)禁忌症对本药过敏者。

(2) 慎用：心动过缓者、运动障碍患者、立性低血压患者、肝功能不全者(血药浓度更高，清除率更低)、肾功能不全者。

(3) 药物对儿童的影响尚无在儿童中使用的研究，儿童不宜使用本药。

(4) 药物对老人的影响 老年患者口服本药，清除率下降15%~30%，应根据临床疗效调整剂量。

(5) 药物对妊娠的影响孕妇慎用。美国药品和食品管理局(FDA)对本药的妊娠安全性分级为C级。

(6) 药物对哺乳的影响尚不清楚本药是否经乳汁分泌，但本药可抑制人类催乳素分泌，可能抑制泌乳。

5. 不良反应：

(1) 心血管系统常见下肢悬垂性水肿。可见直立性低血压(相关症状包括昏厥、不适及呵欠)，持续使用本药的帕金森病患者可产生耐受，偶伴有心动过缓。

(2) 精神神经系统可见嗜睡(20%-40%)、头晕(40%)。也有报道出现突发昏睡、运动障碍、乏力、运动减少、感觉异常、帕金森病症状加重、头痛、精神错乱、幻觉、失眠、震颤和焦虑。骤然减少用量、停药或改变抗帕金森病治疗方案可引起意识错乱。

(3) 代谢/内分泌系统较常见出汗增加。

(4) 胃肠道常有恶心(30%—60%)、呕吐、消化不良、便秘、腹痛、咽炎及口干。

(5) 泌尿生殖系统常见尿路感染。有个案报道出现阴茎勃起伴阴囊痛，停药后消失。

(6) 眼常见视力异常(6%)。在大鼠中曾见视网膜变性，在人类中尚不清楚。

(7) 呼吸系统常见上呼吸道感染(6%)。

(8) 肌肉骨骼系统常见关节疼痛。

(9) 其他骤然减少用量、停药或改变抗帕金森病治疗方案可引起高热。

生产方法及其他：

6. 药物相互作用：

药物—药物相互作用：

(1) 与紫草或蔓荆子合用，多巴胺激动作用相加，发生多巴胺能药不良反应的风险增加，两者合用应谨慎。

(2) 环丙沙星可抑制本药代谢，使本药的曲线下面积和血药峰值浓度增加，发生不良反应(恶心、嗜睡、头晕)的风险增加。

(3) 炔雌醇可降低本药清除率，增加发生不良反应的风险(恶心、嗜睡、头晕)。

(4) 与卡比多巴/左旋多巴合用，可使左旋多巴平均稳态血药峰值浓度升高。

(5) 卡法根可拮抗本药的多巴胺激动作用，降低本药的疗效。

(6) 与茶碱合用，无药动学相互作用。

(7) 与地高辛合用，不影响地高辛的药代动力学。

药物—食物相互作用：食物可使本药达最大疗效的时间延迟2.5小时、曲线下面积轻微降低，但不会影响本药的吸收程度。

7. 给药说明：

(1) 服药期间应避免驾驶车辆。

(2) 预先口服多潘立酮20mg，可控制恶心、直立性低血压。

(3) 当该药与左旋多巴合用时，可能需要逐渐减少左旋多巴的用量(平均减少31%)。

(4) 停药需在7日内逐渐进行。前4日可将服药次数从一日3次减为一日2次，后3日再减为一日1次。

8. 用法与用量：

成人：常规剂量，口服给药。

普通用法：推荐起始剂量为0.25mg，一日3次。应根据个体反应增加剂量，每周可增加剂量0.25mg，一日3次。当日剂量达到3mg后，每日可增加剂量0.5mg，一日3次。当日剂量达到9mg后，每日可增加剂量1mg，一日3次，直到每日总剂量达到24mg。

从服用溴隐亭转为本药：可采用重叠给药方案。第1周，给予本药一日0.75mg；第2周，一日1.5mg；第3周，一日3mg。与此同时，按2:1(溴隐亭:该药)的比例逐步减少溴隐亭的剂量。换药前，溴隐亭的平均用量为18.8mg；换药后，该药的平均用量为8.6mg。肾功能不全时剂量对肌酐清除率为30~50ml/min的患者，因药动学无显著改变，无需调整剂量。对肌酐清除率低于30ml/min的患者，使用本药尚未研究。

9. 制剂与规格：

该药(1)0.25mg；(2)0.5mg；(3)1mg；(4)2mg；(5)4mg；(6)5mg。

10. 其他：

①疏水参数计算参考值(XlogP)：2.7；

②氢键供体数量：1；
③氢键受体数量：2；
④可旋转化学键数量：7；
⑤互变异构体数量：3；
⑥拓扑分子极性表面积 (TPSA)：32.3；
⑦重原子数量：19。

相关化学品信息

[91696-98-9](#) [吡啶-7-硼酸频哪醇酯](#) [91059-32-4](#) [91596-61-1](#) [91459-70-0](#) [91224-36-1](#) [91919-72-1](#) [4-苯基-4,5,6,7-四氢噻吩并\[3,2-c\]](#)
[吡啶](#) [912763-21-4](#) [91313-64-3](#) [91782-50-2](#) [91434-62-7](#) [91698-30-5](#) [91557-05-0](#) [914299-79-9](#) 458

生成时间2015-10-27 9:52:35