

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.chemistry.cn](#)

## CAS Number:122320-73-4 基本信息

中文名:	罗格列酮; 5-[[4-[2-(甲基-2-吡啶氨基)乙氧基]苯基]甲基]-2,4-噻唑烷二酮
英文名:	Rosiglitazone
别名:	5-[[4-[2-(Methyl-2-pyridinylamino)ethoxy]phenyl]methyl]-2,4-thiazolidinedione
分子结构:	
分子式:	C <sub>18</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O <sub>3</sub> S
分子量:	357.43
CAS登录号:	122320-73-4

## 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#122320-73-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

阿达玛斯试剂 专业从事122320-73-4及其他化工产品的生产销售 400-111-6333

江苏贝达医药科技有限公司 罗格列酮专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0512-63008636

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. 122320-73-4 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:	罗格列酮(122320-73-4)的用途: 噻唑烷二酮类胰岛素增敏剂。 适用于非胰岛素依赖型(II型)糖尿病的治疗。 用于治疗糖尿病。
	罗格列酮(122320-73-4)的生产方法: 8.9g 2-(N-甲基-N-(2-吡啶基)氨基)乙醇溶于60ml二甲基甲酰胺, 在氮气保护下, 分批加入0.7g 60%的氢化钠。当剧烈的反应减慢后, 加入2.9g 4-氟苯甲醛, 在80℃加热16h。冷却, 加入400ml水。用3×250ml乙醚萃取, 萃取液合并, 用2×100ml食盐水洗, 干燥, 过滤, 浓缩至干, 得到化合物(I)。  3.2g化合物(I)和1.1g 2, 4-噻唑啉二酮溶于100ml甲苯, 加入催化量的哌啶乙酸盐, 回流2h。冷却, 过滤, 得到化合物(II), 熔点177-190℃。  化合物(II)溶于二氧六环, 在10%Pd-C催化下, 在室温和常压下氢化至氢气吸收停止。过滤, 减压浓缩至干。剩余物用甲醇重结晶, 得罗格列酮, 熔点153~155℃。  罗格列酮(122320-73-4)的药理毒理: 本品属噻唑烷二酮类抗糖尿病药, 通过提高胰岛素的敏感性而有效地控制血糖。本品为过氧化物酶体增殖激活受

体的高选择性、强效激动剂。人类的PPAR受体存在于胰岛素的主要靶组织如肝脏、脂肪和肌肉组织中。本品激活PPAR- $\gamma$ 核受体，可对参与葡萄糖生成、转运和利用的胰岛素反应基因的转录进行调控。此外，PPAR- $\gamma$ 反应基因也参与脂肪酸代谢的调节。在本品临床研究中，空腹血糖(FPG)和HbA1c的检测结果表明，本品可改善血糖控制情况，同时伴有血胰岛素和C肽水平降低，也可使餐后血糖和胰岛素水平下降。本品对血糖控制的改善作用较持久，可维持达52周。2型糖尿病的主要病理生理学特征为胰岛素抵抗。本品的抗糖尿病作用已在2型糖尿病的动物模型(由于靶组织的胰岛素抵抗而出现高血糖症和/或糖耐量下降)中得到显示。可有效地降低ob/ob肥胖小鼠、db/db糖尿病小鼠和fa/faZucker肥胖大鼠的血糖，减轻其高胰岛素血症，并可延缓db/db小鼠和Zucker肥胖大鼠模型的糖尿病发展。动物研究提示，本品的抗糖尿病作用是通过提高肝脏、肌肉和脂肪组织对胰岛素的敏感性而实现，并且在脂肪组织中使胰岛素调控的葡萄糖转运因子GLUT-4的基因表达增加。本品单独使用不会使2型糖尿病和/或糖耐量减低的模型动物出现低血糖。动物毒性：本品小鼠、大鼠、犬给药剂量分别为3mg/kg/日、4mg/kg/日和2mg/kg/日(相当于人日服最大推荐剂量下AUC的5, 22和2倍)时，均发现心脏重量增大，形态学检查可见心室肥大，这可能与血容量增加导致心脏负荷加大有关。遗传毒性：体外细菌基因致突变试验、体外人淋巴细胞染色体畸变试验、小鼠体内微核试验、体内、外大鼠程序外DNA合成试验(UDS)结果均为阴性。小鼠淋巴瘤体外试验中，在代谢活化条件下可见突变率有轻度增加(约2倍)。生殖毒性：本品剂量达40mg/kg/日(相当于人日服最大推荐剂量下AUC的116倍)，对雄性大鼠交配和生育力无影响。本品可改变雌性大鼠的动情周期(剂量2mg/kg/日，相当于人日服最大推荐剂量下AUC的20倍)，降低雌性大鼠的生育力(40mg/kg/日，相当于人日服最大推荐剂量下AUC的200倍)，并伴血中的孕激素和雌激素降低。在0.2mg/kg/日(相当于人日服最大推荐剂量下AUC的3倍)剂量下，未见到上述改变。本品剂量为0.6和4.6mg/kg/日(相当于人日服最大推荐剂量下AUC的3和15倍)，可降低猴子卵泡期血清雌二醇水平，继而使黄体激素水平和黄体期孕酮水平下降，并出现闭经，这可能与本品直接抑制卵巢甾体激素的生成有关。大鼠怀孕早期给予本品，对着床或胚胎无影响；但在妊娠中、晚期给予本品，可引起大鼠和家兔胚胎死亡和生长延滞。大鼠和家兔给药剂量分别达3mg/kg/日和100mg/kg/日(分别相当于人日服最大推荐剂量下AUC的20和75倍)时，未见致畸作用。大鼠给药3mg/kg/日时可使胎盘出现病理改变。大鼠妊娠和哺乳期连续给药可引起窝仔数减少，新生鼠生存能力下降和出生后生长迟缓，但生长迟缓可于青春期后恢复。本品对大鼠、家兔胎盘、胚胎/胎仔和仔代的无影响剂量分别为0.2mg/kg/日、15mg/kg/日，约为人日服最大推荐剂量下AUC的4倍。尚无充分和严格控制的孕妇临床研究资料。只有当其潜在利益大于对胎儿的潜在危险性时，孕妇才可以服用本品。大鼠乳汁中检测到了本品的相关物质，但本品是否经人乳汁分泌尚不清楚。由于许多药物可经人乳汁分泌，故哺乳妇女不宜使用本品。现有资料明显提示，妊娠期间血糖水平异常可增加新生儿先天性畸形的发生率、新生儿的发病率和死亡率，为此大多数专家建议在妊娠期单用胰岛素，以尽可能维持正常的血糖水平。致癌性：小鼠掺食给予本品2年，剂量为0.4、1.5和6mg/kg/日(高剂量相当于人日服最大推荐剂量下AUC的12倍)，未见致癌作用，但在1.5mg/kg/日以上剂量，可引起脂肪组织增生。大鼠经口给予本品2年，剂量为0.05、0.3和2mg/kg/日[高剂量分别相当于人日服最大推荐剂量下AUC的10(雄性)倍和20倍(雌性)]，在0.3mg/kg/日和更高剂量下，可明显增加大鼠良性脂肪组织瘤的发生率。上述两种动物上发现的增生反应与本品对脂肪组织过度而持久的药理作用有关。

#### 罗格列酮(122320-73-4)的药代动力学：

罗格列酮的绝对生物利用度为99%，健康成人一次口服罗格列酮片4mg，1小时后血药浓度达最高，C<sub>max</sub>约为319ng/ml(一次口服罗格列酮片2mg，C<sub>max</sub>为156ng/ml)t<sub>1/2</sub> 3-4小时，该品99.8%分布在血清蛋白(主要是白蛋白)中，该品大部分以代谢物的形式由尿排出，小部分由粪便排出。

#### 罗格列酮(122320-73-4)的适应症：

本品适用于治疗2型糖尿病。单一服用本品，并辅以饮食控制和运动，可控制2型糖尿病患者的血糖。对于饮食控制和运动加服本品或单一抗糖尿病药物，而血糖控制不佳的2型糖尿病患者，本品可与二甲双胍或磺酰脲类药物联合应用。对服用最大推荐剂量二甲双胍或磺酰脲类药物，且血糖控制不佳的患者，本品不可替代原抗糖尿病药物，则需在其基础上联合应用。饮食控制是2型糖尿病治疗的措施之一。限制热量、减轻体重和增加运动均有助于提高胰岛素的敏感性，因而其不仅是2型糖尿病的基本治疗，且可有效地保持药物疗效。在开始服用本品前，应诊治影响血糖控制的病症，如感染。

#### 罗格列酮(122320-73-4)的用法和用量：

口服，服药与进食无关。糖尿病治疗应个体化。单药治疗：初始剂量可为一日4mg，每日一次或分两次口服，如对初始剂量反应不佳，可逐渐加量至一日8mg。与磺酰脲类联合用药：初始剂量可为一日4mg，每日一次或分两次口服，发生低血糖时，减少磺脲类用量。与二甲双胍联合用药：初始剂量可为一日4mg，每日一次或分两次。12周后若空腹血糖控制不理想，剂量增加至一日8mg。最大推荐剂量为每日8mg，每日一次或分两次口服。

生产方法及其他:

罗格列酮(122320-73-4)的不良反应:

1. 轻中度水肿, 文献报导单药治疗时水肿发生率为4.8%。
2. 贫血, 发生率约为1%。本品可能会使血红蛋白和红细胞压积下降, 可能与盐酸罗格列酮造成血浆容量增加有关。
3. 低血糖反应, 合并使用其它降糖药物时, 有发生低血糖的风险。
4. 肝功能异常, 均为轻中度转氨酶升高, 并且可逆。
5. 血脂增高。

罗格列酮(122320-73-4)的禁忌:

1. 轻中度水肿, 文献报导单药治疗时水肿发生率为4.8%。
2. 贫血, 发生率约为1%。本品可能会使血红蛋白和红细胞压积下降, 可能与盐酸罗格列酮造成血浆容量增加有关。
3. 低血糖反应, 合并使用其它降糖药物时, 有发生低血糖的风险。
4. 肝功能异常, 均为轻中度转氨酶升高, 并且可逆。
5. 血脂增高。

罗格列酮(122320-73-4)的注意事项:

1. 本品不适用于1型糖尿病患者和糖尿病酮酸中毒患者。
2. 本品可能会导致停经, 停止排卵妇女的再次排卵, 故服药期间应注意避孕。
3. 服用本品期间, 病人应坚持饮食控制和运动。
4. 病人在服药期间, 若出现一些无法解释的症状如恶心, 呕吐, 腹痛, 疲倦, 食欲不振和深色尿液等, 应立即告诉医生。
5. 在使用罗格列酮或罗格列酮与胰岛素联用时有心脏病发作, 充血性心力衰竭等严重的副作用时, 应与医生联系。
6. 对此类药物过敏者, 以及严重的肝损害和急性心力衰竭患者禁止服用此类药物。

罗格列酮(122320-73-4)的孕妇及哺乳期妇女用药:

孕妇用药的安全性尚未确定, 孕妇和可能怀孕的妇女应权衡利弊。动物(大鼠)实验表明, 本品可移行入乳汁, 服用本品期间应避免哺乳。

罗格列酮(122320-73-4)的儿童用药:

儿童用药的安全性尚未确定。

罗格列酮(122320-73-4)的老年患者用药:

老年患者服用本品时毋需因年龄而调整剂量。

罗格列酮(122320-73-4)的药物相互作用:

1. 经细胞色素P450代谢的药物: 体外药物代谢试验表明, 在临床使用剂量下, 罗格列酮不抑制主要的P450酶。体外试验资料证实, 罗格列酮主要通过CYP2C8代谢, 极少部分经CYP2C9代谢。
2. 尼莫地平和口服避孕药(炔雌醇和炔诺酮)主要经CYP3A4途径代谢, 因此与本品(4毫克, 每日2次)合用, 不会对上述二药物产生具有临床意义的药代动力学影响。
3. 格列本脲: 对于服用格列本脲后病情稳定的糖尿病患者, 本品(2毫克/次, 每日2次)与格列本脲(3.75毫克/日至10毫克/日)合用7天, 不会改变其24小时的平均稳态血糖水平。
4. 二甲双胍: 对于健康受试者, 本品(2毫克/次, 每日2次)与二甲双胍(500毫克/次, 每日2次)合用4天, 不会改变本品及二甲双胍的稳态药代动力学参数。

5. 阿卡波糖: 健康受试者服用阿卡波糖(100毫克/次, 每日3次)7天, 对单剂口服本品的药代动力学参数无影响。

6. 地高辛: 健康受试者连服本品(8毫克/次, 每日1次)14天, 对地高辛(0.375毫克/次, 每日1次)的稳态药代动力学参数无影响。

7. 华法林: 连续服用本品对华法林对映体的稳态药代动力学参数无影响。

8. 乙醇: 服用本品的2型糖尿病患者单次饮用中等量的乙醇, 不会增加其急性低血糖发生的危险性。

9. 雷尼替丁: 健康受试者服用雷尼替丁(150毫克/次, 每日2次)4天, 不会改变罗格列酮单剂口服或静脉给药的药代动力学参数。该结果表明胃肠道pH值升高不影响本品的口服吸收。

罗格列酮(122320-73-4)的药物过量:

根据志愿者临床研究显示: 给予单剂量口服本品不超过20mg者, 耐受性良好。一旦出现药物过量, 可根据患者临床主诉给予适当的对症支持治疗, 一般均可缓解。

罗格列酮(122320-73-4)的贮藏:

遮光, 密封保存。

#### 相关化学品信息

[对二乙氧基苯](#) [122587-20-6](#) [123880-44-4](#) [121071-92-9](#) [1202-60-4](#) [1,1'-二乙酰基二茂铁](#) [123334-06-5](#) [多西他赛](#) [122342-17-0](#) [1249-82-7](#) [123135-06-8](#) [硫硒化镉](#) [123599-82-6](#) [活性翠蓝K-GL](#) [氟化铵](#) [氯铂酸价格](#) [硝酸钪](#) [二甲基吡啶](#)