

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:134308-13-7 基本信息

中文名:	托卡朋; (3,4-二羟基-5-硝基苯基)- (4-甲基苯基) 甲酮
英文名:	Tolcapone
别名:	(3,4-Dihydroxy-5-nitrophenyl)-(4-methylphenyl) methanone
分子结构:	
分子式:	C ₁₄ H ₁₁ NO ₅
分子量:	273.24
CAS登录号:	134308-13-7

物理化学性质

性质描述: 黄色粉末

CAS#134308-13-7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. 134308-13-7](#) 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:	重要的医药中间体□
生产方法及其他:	<p>1. 托卡朋(134308-13-7)的生产方法: 3,4-二羟基苯甲酸和醋酐在氢氧化钠存在下反应, 得到3,4-二乙酰氧基苯甲酸, 再硝化引入硝基。氯化亚砜氯化后, 在三氯化铝作用下, 对甲苯进行酰化, 得到二苯酮衍生物。最后氢氧化钠水溶液水解, 脱去羟基上的乙酰基, 即得托卡朋(134308-13-7)。</p> <p>2. 适应症: 该药用于接受左旋多巴和卡比多巴联合治疗的原发性帕金森病的辅助治疗。</p> <p>3. 用法用量: 口服。推荐剂量为100mg一日三次。作为左旋多巴/卡比多巴治疗的叠加用药。该药一日口服三次。白天的第一剂应与左旋多巴制剂白天的第一剂同时服用, 此后约间隔6和12小时再服药。该药可与或不与食物同服, 它可与左旋多巴/卡比多巴的常释和缓释剂型合用。在临床试验中, 如果患者每日左旋多巴剂量超过600mg或在治疗开始前有中度或重度的运动障碍, 则大多数患者需减少其每日左旋多巴剂量。</p> <p>伴有肝功能或肾损伤的患者:因服用本品有损害肝脏的危险, 任何有肝脏疾病的患者均不能服用本品。因此, 开始服用本品时患者的SGPT/ALT或SGOT/AST均不得超过正常值的上限或者肝功能有其他异常改变。对于轻度或中度肾损伤者无需作剂量调整, 重度肾功能损伤的患者需使用本品时, 应极为慎重。对于肌酐清除率低于25mg/min的患者的该药用药安全性尚未确定。</p> <p>4. 不良反应: 据国外临床研究资料显示: (1)上市后发生的与该药相关的严重不良事件。在上市后的应用中已报告有肝细胞损伤, 包括暴发性肝功能衰竭而导致死亡的病例。在1998年10月在近60000名服用该药的病例中有3例发生了致命性暴发性肝功能衰竭, 在世界</p>

范围内每年大约有40000名患者服用该药。其发病率高于普通人群约10-100倍。服用该药而增加肝功能损伤的问题不可忽视。

(2) 上市前的临床研究中发现的不良事件。(以下所列不良事件与服用该药是否有因果关系尚不明确)。在随机双盲与安慰剂对照的临床研究中发现的不良事件如下:发生率>5%的不良事件为:运动障碍、恶心、睡眠紊乱、肌张力障碍、多梦、厌食、肌肉痛性痉挛、直立性不适、嗜睡、腹泻、精神错乱、眩晕、头痛、幻觉、呕吐、便秘、疲劳、上呼吸道感染、虚脱、多汗、尿道感染、口干、腹痛、尿变色。

以下按各系统排列。(常见事件的发生率为大于1/100;偶见事件的发生率为1/100至1/1000;罕见事件的发生率为小于1/1000)。

神经系统——常见:抑郁、焦虑、嗜睡、感觉减退、震颤、语言障碍、眩晕、情绪不稳;偶见:神经痛、记忆缺失(遗忘症)、锥体外系症状、故意、性欲增加、躁狂反应、神经过敏、类偏执妄想反应、脑缺血、脑血管意外、妄想、性欲减退、神经病、情感淡漠、舞蹈病、手足徐动症、肌阵挛、精神病、思维异常、抽搐;罕见:人格变态、谵忘、脑病、偏瘫、脑膜炎。

消化系统——常见:牙齿疾病;偶见:吞咽困难、胃肠道出血、胃炎、口腔溃疡、流涎增多、大便异常、食管炎、胆石病、结肠炎、舌疾、直肠疾病;罕见:胆囊炎、十二指肠溃疡、胃肠道肿瘤,胃张力缺乏。

全身性疾病——常见:肋部疼痛、意外损伤、腹痛、感染、虚弱、体重减轻;偶见:疝、疼痛、过敏反应、蜂窝织炎、真菌感染、病毒感染、癌症、寒战、细菌感染、赘生物、脓肿、面部水肿、罕见:死亡。

心血管系统——常见:心悸;偶见:高血压、血管扩张、心绞痛、心衰、心房纤颤、心动过速、偏头痛、主动脉狭窄、心律失常、动脉痉挛、心动过缓、脑出血、冠脉疾病、心脏骤停、心肌梗塞、心肌缺血、肺栓塞;偶见:动脉硬化、心血管疾病、心包积液、血栓形成。

肌肉骨骼系统——常见:肌痛、关节痛、肢体痛、骨折;偶见:腱鞘炎、关节炎、关节疾病。

泌尿生殖系统——常见:尿淋漓、阳痿;偶见:前列腺疾病、排尿困难、夜尿症、尿频、尿潴留、子宫弛缓、子宫疾病、阴道炎。罕见:膀胱结石、卵巢癌、子宫出血。

呼吸系统——常见:支气管炎、咽炎、肺炎;偶见:咳嗽增多、鼻炎、哮喘、鼻出血、呼吸性碱中毒、喉炎、呃逆;罕见:窒息、缺氧、肺水肿。

皮肤及附属物——常见:皮疹。偶见:带状疱疹、瘙痒、脂溢性皮炎、皮肤褪色、湿疹、多形红斑、皮肤病、疖病、单纯疱疹、荨麻疹。

特殊感觉——常见:耳鸣、蓝视症、窦炎;偶见:复视、耳痛、眼出血、眼痛、流泪失常、中耳炎、嗅觉倒错;罕见:青光眼。

代谢和营养——常见:水肿、高胆固醇血症、口渴、脱水。

血液和淋巴系统——常见:贫血;罕见:白血病、血小板减少。

内分泌系统——偶见:糖尿病。

未分类——常见:外科手术。

5. 禁忌症:

- (1) 患肝脏疾病的患者以及目前SGPT/ALT或SGOT/AST超过正常值上限的患者禁用本品;
- (2) 严重肾功能损害的患者禁用本品;
- (3) 对该药及本品中任何其它成份过敏者禁用本品;
- (4) 具有非创伤性横纹肌溶解病史的患者禁用本品;
- (5) 在某些疾病状态下曾出现过高热和意识模糊的患者禁用本品;
- (6) 服用该药时,不应与非选择性单胺氧化酶抑制剂(如苯乙肼及反苯环丙胺)合用。
- (7) 服用该药时,不应同时加用单胺氧化酶A抑制剂和单胺氧化酶B抑制剂。

6. 注意事项:

(1) 肝功能:据国外文献报道,该药在国外上市后的临床应用中发现有导致患者严重的、致命的、急性的肝细胞损害的情况,因此,在选择给予该药治疗的患者时,应极为慎重。在开始用药前,首先检查患者的血清SGPT/ALT和SGOT/AST,确定基础水平,然后在治疗的第一年应每两周检查一次SGPT/ALT和SGOT/AST,以后的6个月里每4周检查一次,此后每8周检查一次。如果一旦超过正常上限或出现肝功能损伤的临床症状及体征(持续性恶心、乏力、厌食、黄疸、尿色加深、搔痒及右上腹不适等),应立即停药。

(2) 低血压/晕厥：该药可增加左旋多巴的生物利用度，因而可增加直立性低血压的发生率，需注意。尤其对曾有过低血压/晕厥发作史的患者，应更为谨慎。患者不要从坐或躺姿快速抬高体位，尤其已经保持这种姿势很长时间，更不能迅速转变体位，以防出现晕厥。

(3) 腹泻：服用该药后可能会出现不同程度的腹泻，通常在服药后6至12周出现，但部分患者也可能提前或延迟。服药期间如出现中至重度的腹泻患者，需停药。

(4) 幻觉：在服用该药的患者中可能出现幻觉，需注意监测。一旦发生幻觉，可通过减少左旋多巴的用量达到改善，如仍无明显好转，则需停药。

(5) 运动障碍、肌张力降低、恶心及其它与左旋多巴有关的不良反应：服用该药时，患者会感觉与左旋多巴有关的不良反应加重。减少左旋多巴的剂量时，这些不良反应往往减轻。

(6) 若停用该药，医生应考虑增加患者每日左旋多巴的剂量，防止发生神经抑制性恶性综合症。

(7) 尿液变色：该药及其代谢物呈黄色，可引起患者尿色无害性加深。

(8) 在服用该药期间，可能出现反应力下降，不要驾车或操作复杂机器。

7. 孕妇及哺乳期妇女用药：

目前尚无充分的该药用于孕妇的临床研究资料，因此，其用于孕期的安全性和有效性尚不明确，不应使用。动物实验显示该药可分泌入母乳，因此，哺乳期的妇女如需服用该药时应停止哺乳。

8. 儿童用药：

尚无资料证明该药可用于儿科患者。

9. 药物过量：

一旦出现过量，患者可出现恶心、呕吐和头晕等多种表现，目前尚未发现该药的特效拮抗剂。针对其过量应按照药物过量的常规处理原则进行对症、支持治疗。血液透析可能无效。

10. 贮藏：

遮光、密闭、干燥处贮存。

详情请看

相关化学品信息

132767-55-6	139165-54-1	130286-70-3	134-19-0	13531-90-3	13037-57-5	乙醛缩二(3-甲基丁醇)	13464-80-7
130986-21-9	13178-41-1	13394-86-0	13043-66-8	二(2-噻吩基)乙醇酸东莨菪酯	13598-57-7	帕立骨化醇	443

生成时间2021/5/16 7:00:07