



本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[134308-13-7](https://www.ichemistry.cn/cas/134308-13-7), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](https://www.ichemistry.cn)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](https://www.ichemistry.cn)

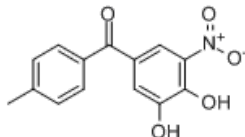
## CAS Number:134308-13-7 基本信息

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](https://www.ichemistry.cn/cas/134308-13-7) 查看若您在此化学品供应商, 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:

## 1. 托卡朋(134308-13-7)的生产方法:

3,4-二羟基**苯甲酸**和**酞酐**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。**氯化亚砷**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)。

## 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。

## 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。

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。

## 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

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、敌意、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、胃肠炎、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：胸部疼痛、意外损伤、腹痛、感染、虚弱、体重减轻；偶见：疔、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、瘙痒及右上腹不适等)，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，这些不良反应往往会减轻。
- (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

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

443

生成时间2021/5/16 7:00:07