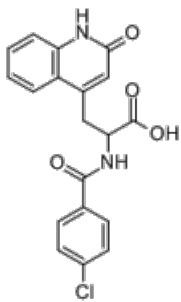




本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[90098-04-7](#), 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:90098-04-7 基本信息

中文名:	瑞巴派特; 瑞巴匹特; 瑞巴米特; 2-(4-氯苯甲酰胺基)-3-(1,2-二氢-2-氧代-4-喹啉基)丙酸
英文名:	Rebamipide
别名:	2-(4-Chlorobenzoylamino)-3-(1,2-dihydro-2-oxo-4-quinolyl)propionic acid
分子结构:	
分子式:	C ₁₉ H ₁₅ ClN ₂ O ₄
分子量:	370.79
CAS登录号:	90098-04-7

物理化学性质

性质描述:	<p>瑞巴派特 (90098-04-7) 的化学性质:</p> <p>从二甲基甲酰胺-水得白色粉末。 其半水合物熔点288~290℃ (分解)。</p> <p>(-)-构型: 从二甲基甲酰胺得无色针状结晶, 熔点305~306℃ (分解)。 [α]_D²⁰-116.7° (C=1.0, 二甲基甲酰胺)。</p> <p>(+)-构型: 从二甲基甲酰胺得无色针状结晶, 熔点305~306℃ (分解)。 [α]_D²⁰+116.9° (C=1.0, 二甲基甲酰胺)。</p>
-------	---

CAS#90098-04-7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. 90098-04-7 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:	新型抗溃疡药。
	<p>瑞巴派特 (90098-04-7) 的生产方法:</p> <p>消旋瑞巴派特的制备。以2(1H)-喹啉酮-4-羧酸甲酯(I)为原料, 经氢硼化锂还原为2(1H)-喹啉-4-基甲醇(II), 再和氢溴酸作用溴化为4-溴甲基-2(1H)-喹啉酮(III)。</p> <p>乙酰氨基丙二酸二乙酯(12.0g, 55mmol)和金属钠(1.5g, 65mmol)溶于150ml无水乙醇, 加热至沸, 在搅拌下加入(III)(12.0g, 50mmol), 再回流2h。减压浓缩, 剩余物倾入水。过滤收集析出的沉淀, 用乙醇重结晶, 得13.0g无</p>

色棱状结晶的化合物(IV)，收率69%，熔点224～226℃(分解)。

化合物(IV) (5.0g, 13mmol)悬浮于150ml 20%[盐酸](#)，回流9h。减压浓缩至干，剩余物用乙醇-水重结晶，得3.2g无色棱状结晶的化合物(V)，收率89%，熔点220～225℃(分解)。

化合物(V) (2.7g, 10mmol)和[碳酸钾](#) (4.2g, 30mmol)溶于100ml [丙酮](#)和20ml水的混合溶液，在冰浴冷却和搅拌下，滴入对[氯苯甲酰氯](#) (2.1g, 12mmol)，再搅拌2h。减压蒸去丙酮，剩余液用稀盐酸酸化。过滤收集析出的沉淀，用甲醇-水重结晶，得1.8g白色粉末状的瑞巴派特，收率49%，熔点288～290℃(分解)。

(-)-构型的制备。从消旋体拆分而得。21.6g消旋瑞巴派特悬浮于1100ml甲醇，加入23g(-)-二甲马钱子碱(brucine)，形成的澄清溶液在室温下搅拌4h，再冷却过夜。过滤收集析出的沉淀，用冷甲醇洗。再重结晶4次得7.6g纯的盐， $[\alpha]_D^{20}+60.4^\circ$ (C=1.0, [氯仿](#))。将10%盐酸加到该盐的甲醇悬浮液中，过滤析出的沉淀，用水洗。然后用二甲基甲酰胺-水重结晶3次，得1.6g无色针状结晶的(-)-构型的瑞巴派特，收率14.8%，熔点305～306℃， $[\alpha]_D^{20}-116.7^\circ$ (C=1.0, 二甲基甲酰胺)。

(+)-构型的制备。将从上述(-)-构型的制备中第1次母液中得到的固体溶于甲醇，加入10%盐酸。过滤析出的沉淀，水洗后，悬浮于甲醇，再加入(-)-二甲马钱子碱，在室温搅拌1h。过滤除去不溶物，往滤液中加入浓盐酸。过滤收集析出的沉淀，水洗。用二甲基甲酰胺-水重结晶4次，得3g无色针状结晶的(+)-构型的瑞巴派特，收率27.8%，熔点305～306℃(分解)， $[\alpha]_D^{20}+116.9^\circ$ (C=1.0, 二甲基甲酰胺)。

瑞巴派特(90098-04-7)的用法用量：

胃溃疡：通常成人一次100mg(一次1片)，一天3次，早、晚及睡前口服。急性胃炎、慢性胃炎的急性加重期胃粘膜病变(糜烂、出血、充血、水肿)的改善。通常成人一次100mg(一次1片)，一天3次，口服。

瑞巴派特(90098-04-7)的药理作用：

据国外文献报道：

1. 对实验性胃溃疡的抑制作用及促进治愈的作用：本品可抑制大白鼠的水浸刺激溃疡、阿司匹林溃疡、[吡咪美辛](#)溃疡、组胺溃疡、血清基溃疡、幽门结扎溃疡及与活性氧有关的缺血一再灌注、血小板活化因子(FAF)、二乙基二硫代氨基甲酸盐(DDC)、应激反应、[吡咪美辛](#)等引起的胃粘膜损伤，还可以促进大白鼠[醋酸](#)溃疡的治愈，并抑制溃疡形成后第120～140天的复发。

2. 对实验性胃炎的抑制作用及促进治愈的作用：本品不仅抑制牛磺胆酸诱发的大白鼠实验性胃炎的发生，而且具有促进治愈的效果。

3. 增加胃粘膜前列腺素的作用：本品使大白鼠胃粘膜内前列腺素E₂含量增加，并使胃液中前列腺素E₂、前列腺素I₂增加，同时也使前列腺素E₂的代谢产物15-酮基-13, 14-二氢(化)前列腺素E₂增加。本品使健康成年男子的胃粘膜中前列腺素E₂含量增加，并显示它对乙醇负荷引起的胃粘膜损伤有抑制作用。

4. 保护胃粘膜的作用：本品可抑制乙醇、强酸及强碱导致大白鼠的胃粘膜损伤，还可以抑制阿司匹林及牛磺胆酸对家兔胎仔的胃粘膜上皮细胞的损伤，抑制阿司匹林。乙醇、盐酸一乙醇负荷对健康成年男子的胃粘膜损伤。

5. 增加胃粘液量的作用：本品可提高大白鼠粘液高分子糖蛋白的生物合成酶活性，使胃粘膜表层粘液量及可溶性粘液量增加。可溶性粘液增加作用与内源性前列腺素无关。

6. 增加胃粘膜血流量的作用：本品使大白鼠粘膜血流量增加，可改善失血造成的血液循环障碍。

7. 对胃粘膜屏障的作用：本品对大白鼠的胃粘膜电位差几乎不显示作用，但它可以抑制乙醇引起的胃粘膜电位差低下。

生产方法及其他：

	<p>8. 对胃碱性物质分泌亢进作用：本品使大白鼠的胃碱性物质分泌亢进。</p> <p>9. 促进胃粘膜细胞再生的作用：本品使大白鼠的胃粘膜细胞再生能力加强，增加表层上皮细胞数。</p> <p>10. 修复损伤胃粘膜的作用：本品可以使家兔的培养胃粘膜上皮细胞创伤修复模型因胆汁酸及过氧化氢而披拖延的修复过程正常化。</p> <p>11. 对胃酸分泌的作用：本品对大白鼠的基础胃液分泌几乎不起作用， 而且对刺激胃酸分泌来显示出抑制作用。</p> <p>12. 对活性氧的作用：本品具有消除羟基自由基的作用，并抑制多形核白细胞的过氧化物的产生。在体外抑制幽门螺旋杆菌引起的中性白细胞的活性氧产生造成的胃粘膜损伤。 本品在抑制应激反应、吲哚美辛负荷大白鼠的胃粘膜损伤的同时，使胃粘膜中过氧化脂质含量降低。</p> <p>13. 对胃粘膜炎性细胞浸润的作用：通过大鼠的牛磺胆酸诱发胃炎模型、NSAIDs胃粘膜损伤模型、缺血一再灌注模型研究后发现，本品可抑制炎性细胞浸润。</p> <p>14. 对胃粘膜炎性细胞因子(白介素-8)的作用：本品可以抑制幽门螺旋杆菌引起的人胃粘膜上皮细胞白介素-8 (IL-8)产生的增加， 而且可以抑制上皮细胞内NF-κB的活化及IL-8mRNA的出现(体外)。</p> <p>瑞巴派特(90098-04-7)的适应症：</p> <p>胃溃疡、急性胃炎、慢性胃炎的急性加重期胃粘膜病变(糜烂、出血、充血、水肿)的改善。</p> <p>瑞巴派特(90098-04-7)的不良反应：</p> <p>据国外文献报道：在被调查的10047例病例中有54例(0. 54%)出现了包括临床检验值异常在内的副作用。其中65岁以上的老年患者3035例中有18例(0. 59%)出现了副作用。在副作用的种类，发生率方面未显示老年人与非老年人间的差异。</p> <p>瑞巴派特(90098-04-7)的注意事项：</p> <p>1. 禁忌：对本品成分有过敏既往史的患者禁止服用。</p> <p>2. 孕妇及哺乳期妇女用药</p> <p>(1)由于妊娠给药的安全性尚未确认，对于孕妇或可能已妊娠的妇女，只有在判断治疗上的有益性大于危险性时才可以给药。</p> <p>(2)根据动物实验(大白鼠)报告，药物可向母乳中转移，故哺乳期妇女用药时应避免哺乳。</p> <p>3. 儿童用药：本品对于小儿的安全性尚未确认(使用经验少)。</p> <p>4. 老年患者用药：由于一般老年患者生理机能低下，应注意消化系统的副作用。</p>
相关化学品信息	
二乙烯基苯与苯乙烯和乙烯基乙苯的聚合物 9085-99-8 ABS树脂 90293-10-0 90467-75-7 90714-28-6 90430-51-6 90131-61-6 90643-06-4 904813-84-9 阿尔伯特试剂A-21, 属离子交换树脂 90055-48-4 9026-97-5 来檬(CITRUS AURANTIFOLIA)果提取物 3-氯-5-氟苯甲醛 459	
生成时间2014-6-5 10:01:27	