

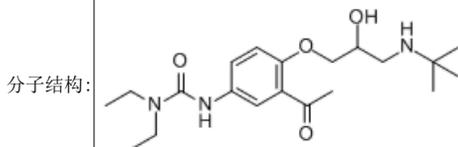


本PDF文件由 爱化学 ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[56980-93-9](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:56980-93-9 基本信息

中文名:	塞利洛尔; 3-[3-乙酰-4-(2-羟基-3-叔丁氨基丙氧基)苯基]-1,1-二乙基脲
英文名:	Celiprolol
别名:	3-[3-Acetyl-4-(2-hydroxy-3-tert-butylamino-propoxy)-phenyl]-1,1-diethyl-urea



分子式:	C <sub>20</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>
分子量:	379.49
CAS登录号:	56980-93-9
EINECS登录号:	260-497-7

CAS#56980-93-9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. 56980-93-9](#) 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: 塞利洛尔(56980-93-9)的用途:  
该药是有高度选择性的β<sub>1</sub>-受体阻滞剂, 兼有血管扩张作用。用于治疗心绞痛、高血压, 对同时有心力衰竭、慢性阻塞性呼吸道疾病和糖尿病的患者尤为适宜。

生产方法及其他:

1. 塞利洛尔(56980-93-9)的生产方法:

①对氨基苯乙酰(20g, 0.145mol) (I)、碳酸氢钾(29.2g, 0.29mol)和40mL丙酮混合, 在室温下滴加N,N-二乙基胍甲酰胺(21.5mL, 0.16mol), 约6h加完。再反应40h, 然后加100mL水, 用4mol/L盐酸调至pH值6。再反应1h。滤集结晶, 水(3×30mL)洗至中性, 干燥, 乙酸乙酯重结晶, 得30g化合物(II), 收率88%。

②化合物(II) (9g, 0.0375mol)、30mL二氯甲烷和乙酰氯(4.1mL, 0.057mol)混合, 在室温下分批加入无水三氯化铝(15g, 0.112mol), 约100min加完。再反应3h。倾入冰水中, 置冰箱中过夜。滤集析出的结晶, 水洗, 干燥。粗品和苯共沸脱水, 冷却后析出化合物(III)的结晶, 得9g, 收率96%。

③化合物(III) (12.5, 0.05mol)和环氧氯丙烷(42.4mL, 0.54mol)混合, 在50℃滴加5mL40%氢氧化钠溶液, 约2h滴完。再反应2h。减压蒸除水及过量的环氧氯丙烷, 加入80mL苯, 用饱和氯化钠水溶液(3×50mL)洗。减压蒸除苯, 加入60mL丙酮, 在室温下加入7mL48%氢溴酸和50mL水, 再反应3h。滤集结晶, 干燥, 得13g化合物(V), 收率67%。

④化合物(V)和叔丁胺反应, 即可得到本品, 加盐酸可得盐酸塞利洛尔。

2. 塞利洛尔(56980-93-9)的药理毒理:

本品是一种高选择性β-受体阻滞剂, 通过阻滞β<sub>1</sub>-受体, 扩张血管, 降低血压。本品高选择性地和心肌细胞膜上β<sub>1</sub>-受体结合, 其亲和力比支气管和血管平滑肌β<sub>2</sub>-受体强20~30倍。能降低休息和运动时的心率与心输出量, 降低运动时的收缩压, 抑制异丙肾上腺素诱导的心动过速。对健康人, 本品不能逆转β<sub>2</sub>-受体介导的异丙肾上腺素的血管舒张效应。本品有内在拟交感活性, 不增加呼吸道阻力, 扩张外周血管, 改善血液循环。本品无膜稳定

化作用也不抑制心肌收缩力,比其它无内源拟交感活性的 $\beta$ -受体阻滞剂引起窦性心动过缓的可能性要小。本品能通过胎盘屏障。

### 3. 塞利洛尔(56980-93-9)的药代动力学:

本品口服后大约有30%能被吸收,服药后2~4小时血药浓度达峰值。约30%的本品以可逆方式和血浆蛋白结合,消除半衰期为2~3小时。本品能通过胎盘屏障,在体内不被代谢,以原形排出,其中10%从尿中、85%从粪便中排出。

### 4. 适应症:

轻、中度高血压。

### 5. 用法用量:

口服:一次0.1~0.3g,一日一次,早上服或遵医嘱。

### 6. 不良反应:

可有头痛、头晕、乏力、困倦、嗜睡及恶心,一般反应轻微,偶见心悸、震颤,通常无需停药,罕见抑郁症及过敏反应。如果出现支气管痉挛、皮疹等与 $\beta$ -阻滞剂有关的副反应时应停药。

### 7. 塞利洛尔(56980-93-9)的注意事项:

(1)除对心脏的 $\beta$ -受体( $\beta_1$ -受体)有阻断作用外,对支气管及血管平滑肌的 $\beta$ -受体( $\beta_2$ -受体)亦有阻断作用,可引起支气管痉挛及鼻粘膜微细血管收缩,故忌用于哮喘及过敏性鼻炎病人。

(2)忌用于窦性心动过缓、重度房室传导阻滞、心源性休克、低血压症病人。充血性心力衰竭病人(继发于心动过速者除外),须等心衰得到控制后始可用本品。不宜与抑制心脏的麻醉药(如乙醚)合用。

(3)有增加洋地黄毒性的作用,对已洋地黄化而心脏高度扩大、心率又较不平稳的病人忌用。

(4)不宜与单胺氧化酶抑制剂(如帕吉林)合用。

(5)本品剂量的个体差异较大,宜从小到大试用,以选择适宜的剂量。长期用药时不可突然停药。

(6)副作用可见乏力、嗜睡、头晕、失眠、恶心、腹胀、皮疹、晕厥、低血压、心动过缓等,须注意。

### 8. 规格:

片剂:200mg。

## 相关化学品信息

<a href="#">56640-11-0</a>	<a href="#">56934-18-0</a>	<a href="#">56544-22-0</a>	<a href="#">56396-35-1</a>	<a href="#">2-甲基-3-戊醇</a>	<a href="#">56797-40-1</a>	<a href="#">56599-88-3</a>	<a href="#">5604-74-0</a>	<a href="#">2-氨基-4,6-二氯嘧啶-5-甲醛</a>
		<a href="#">4-氯-3-羟基苯甲醛</a>	<a href="#">56588-54-6</a>	<a href="#">56153-37-8</a>	<a href="#">?蒂巴因</a>	<a href="#">56531-57-8</a>	<a href="#">5671-78-3</a>	428

生成时间2021/1/14 22:23:46