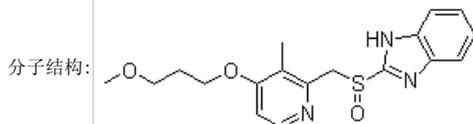


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[117976-89-3](#), 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.icchemistry.cn](#)

CAS Number:117976-89-3 基本信息

中文名:	雷贝拉唑; 2-[[4-(3-甲氧基丙氧基)-3-甲基吡啶-2-基]甲基亚磺酰基]-1H-苯并咪唑
英文名:	Rabeprazole
别名:	2-[[4-(3-methoxypropoxy)-3-methyl-pyridin-2-yl]methylsulfinyl]-1H-benzoimidazole

分子式: $C_{18}H_{21}N_3O_3S$

分子量: 359.45

CAS登录号: 117976-89-3

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#117976-89-3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. 117976-89-3](#) 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:	雷贝拉唑(117976-89-3)的用途: 质子泵抑制剂, 治疗胃-食道胃酸反流(GERD), 十二指肠溃疡。 包括治疗白天和夜间和胃灼热及其他胃-食管反流性疾病(GERD)相关的症状。
-------	---

雷贝拉唑(117976-89-3)的制法:

2, 3-二甲基-4-硝基吡啶-N-氧化物溶于二氯甲烷, 滴加三氟乙醚, 加毕回流4h。蒸出过量的三氟乙醚, 加入二氯甲烷。冷至室温, 加入三乙胺和2-巯基苯并咪唑, 反应至完全。蒸出溶剂, 加入乙醇和水, 搅拌30min。过滤, 得2-[[3-甲基-4-硝基-2-吡啶基]甲基]硫]-1H-苯并咪唑。该化合物和碳酸钾悬浮于3-甲氧基-1-丙醇和异丙醇中, 在85°C加热48h。冷至20°C, 加入氯仿, 过滤, 滤液用水洗。有机层减压浓缩至干, 剩余物柱层析得2-[[3-甲基-4-(3-甲氧基丙氧基)-2-吡啶基]甲基]硫]-1H-苯并咪唑。该化合物溶于二氯甲烷, 在-20°C和搅拌下, 滴加m-CPBA的二氯甲烷溶液, 搅拌30min。加入水, 用10%氢氧化钠调pH至10.40, 再用氨水调pH至10.85。分出有机层, 再加入水, 用10%氢氧化钠调pH至13.0。分出水层, 加入二氯甲烷, 在搅拌下用氨水调pH至10.50。分出有机层, 减压浓缩, 丙酮重结晶, 得产物。

雷贝拉唑(117976-89-3)的药理作用:

雷贝拉唑钠属于抑制分泌的药物, 是苯并咪唑的替代品, 无抗胆碱能及抗H2组胺特性, 但可附着在胃壁细胞表面通过抑制H⁺/K⁺-ATP酶来抑制胃酸的分泌。此酶系统被看作是酸质子泵, 故雷贝拉唑钠作为胃内的质子泵抑制剂阻滞胃酸的产生, 此作用是剂量相关性的。动物试验证实雷贝拉唑钠在用药后不久即可从血浆和胃粘膜中排出。

雷贝拉唑(117976-89-3)的抑制胃酸分泌特性:

在口服雷贝拉唑钠20mg后一小时内发挥药效，在2~4小时内血药浓度达峰值，在初次用雷贝拉唑钠23小时后可抑制基础胃酸量和由食物刺激产生的胃酸量，抑制率分别为69%和82%，且时间可长达48小时，此作用时间明显长于药代动力学中的半衰期(约1小时)。作用机制为抑制H⁺/K⁺-ATP酶。雷贝拉唑钠对胃酸分泌的抑制作用随剂量增加可轻微增强，但在三天后可达稳定水平。即使在停药后，此稳定水平也可保持2~3天。

雷贝拉唑(117976-89-3)的毒理研究：

1. 对大鼠以5mg/kg剂量进行2年的口服毒性试验，在雌性大鼠胃部发现类癌瘤。
2. 动物实验(大鼠口服25mg/kg以上)，发现甲状腺重量及血中甲状腺素增加，因此服用时要注意甲状腺功能。

雷贝拉唑(117976-89-3)的对血清胃泌素的影响：

临床实验中，患者接受雷贝拉唑钠10mg或20mg，1次/日，疗程为24个月的治疗。血清胃泌素水平在用药2~8周内升高。通常在停药后一到两周内血清胃泌素值可恢复到治疗前的水平。

雷贝拉唑(117976-89-3)的适应症：

本品适用于以下治疗：

1. 活动性十二指肠溃疡。
2. 良性活动性胃溃疡。
3. 伴有临床症状的侵蚀性或溃疡性的胃-食管返流征(GORD)。
4. 与适当的抗生素合用，可根治幽门螺旋杆菌阳性的十二指肠溃疡。
5. 侵蚀性或溃疡性胃-食管返流征的维持期治疗。目前疗程超过12个月的药效尚未进行评估。

雷贝拉唑(117976-89-3)的禁忌：

1. 对雷贝拉唑钠，苯并咪唑替代品或对该制剂制备中使用的任何赋形剂过敏的患者禁用。
2. 孕妇和哺乳期妇女禁用。

雷贝拉唑(117976-89-3)的用法用量：

1. 本品不能咀嚼或压碎服用，应整片吞服。与适当的抗生素合用，可根治幽门螺旋杆菌阳性的十二指肠溃疡。本品应在早晨、餐前服用，尽管用药时间及摄食对雷贝拉唑钠药效无影响，但此种给药方式更有利于治疗的进行。

2. 肝肾功能不全患者的用药：

肝肾功能不全患者在用药过程中无需进行剂量调节。但在对有严重的肝肾功能不全患者用药时，应参见“不良反应及注意事项”。

生产方法及其他：

雷贝拉唑(117976-89-3)的不良反

据国外文献报道：

1. 严重副作用：

- (1) 休克：有报道本品有发生过敏、休克的副作用，因此若发现异常应立即停止服用，并进行妥善处理。
- (2) 血液：本品罕见引起各类血细胞减少，血小板降低，粒细胞缺乏，溶血性贫血等。但偶可引起粒细胞减少，贫血等，发现异常，立即停止服用，并进行治疗。
- (3) 视力障碍：国外服用本药，有发现视力障碍的报告。

2. 最常见的不良反应为头痛、腹泻和恶心。其它的不良反应有鼻炎、腹痛、虚弱、胃肠胀气、咽炎、呕吐、非特异性的疼痛或背痛、头晕、流感症状、感染性咳嗽、便秘和失眠。

3. 不良反应有瘙痒、皮疹、心悸、肌痛、胸痛、口干、消化不良、神经过度敏感、嗜睡、支气管炎、鼻窦炎、畏寒、嗝气、腿部抽搐、尿道感染、关节炎和发热、四肢无力、感觉麻木、握力下降、步履不稳、疲倦感。

4. 少见的不良反应应有：厌食、胃炎、体重增加、抑郁、瘙痒症、视觉/嗅觉功能障碍、口炎、发汗和白细胞增多症。

5. 2%的患者出现肝酶的升高, 如ALT、AST、AI-P、 γ -GTP、LDH总胆红素上升。

6. 有报道出现大疱疹或其他皮肤反应包括红斑。当出现皮肤病损时应立即停药。

雷贝拉唑(117976-89-3)的注意事项:

1. 用雷贝拉唑钠治疗的反应不排除存在胃或食道癌。因此在用本品开始治疗之前应排除存在癌症的可能性。尽管在年龄和性别匹配的轻中度肝脏损伤患者与正常者的对照研究中, 未见到明显与药物相关的安全问题, 但是重度肝损伤患者初次使用本品治疗时, 医生建议要特别注意。

2. 服用本品时, 应定期进行血液检查及血液生化学(如肝酶检查), 发现异常, 即停止用药, 并进行及时处理。

3. 肝功能损伤的患者慎用。

雷贝拉唑(117976-89-3)的药物相互作用:

雷贝拉唑钠是作为其他质子泵抑制剂(PPI)类化合物中的一员, 通过细胞色素P450(CYP450)肝脏药物代谢系统代谢, 健康受试者研究表明雷贝拉唑钠与其他通过 CYP450系统代谢的药物, 如华法林、苯妥英、茶碱或地西洋无临床上明显的相互作用关系。

雷贝拉唑钠可长期持续地抑制胃酸分泌。本品与依赖PH吸收的化合物存在相互作用, 因此应该对潜在的相互作用关系进行调查。正常受试者同时服用雷贝拉唑钠结果导致酮康唑水平下降33%, 地高辛水平升高22%。因此需要对患者个体进行检测以确定当这些药物与本品同时服用时是否需要剂量调整。在临床试验中, 同时服用抗酸药物和本品, 在一个确定该相互作用的特殊研究中, 未观察到液体抗酸药物的相互作用。本品与食物无临床上相应的相互作用。

人体肝脏微粒体体外研究表明雷贝拉唑钠可被CYP450的同功酶(CYP2C19和CYP3A4)代谢。研究表明有较低的潜在相互作用, 然而, 对环孢菌素代谢的影响与以前观察过的其他质子泵抑制剂是相似的。

雷贝拉唑(117976-89-3)的药物过量:

无已知的特效的解毒剂。

雷贝拉唑钠可广泛与蛋白结合, 因此, 不易透析。

应该根据症状治疗。

相关化学品信息

[115661-91-1](#) [115664-57-8](#) [马来酸](#) [115722-22-0](#) [118171-04-3](#) [115199-84-3](#) [114366-10-8](#) [114485-81-3](#) [112197-16-7](#) [枸橼酸莫沙必利](#) [118-50-3](#) [116-74-5](#) [112649-21-5](#) [110543-85-6](#) [1125-64-0](#) [硝酸铯](#) [氰基硼氢化钠](#) [碘化铅](#)