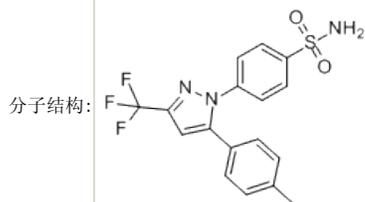


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[169590-42-5](#), 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:169590-42-5 基本信息

中文名:	塞来西布; 塞内昔布; 赛利克西; 4-[5-(4-甲基苯基)-3-(三氟甲基)吡唑-1-基]苯磺酰胺
英文名:	Celecoxib
别名:	4-[5-(4-Methylphenyl)-3-trifluoromethyl-1H-pyrazol-yl]benzenesulfonamide

分子式: $C_{17}H_{14}F_3N_3O_2S$

分子量: 381.37

CAS登录号: 169590-42-5

物理化学性质

熔点: 157-159°C

性质描述: 塞来昔布 (169590-42-5) 的性状:

1. 白色或淡黄色结晶粉末;
2. 溶于**乙酸乙酯**;
3. 熔点157~159°C。

安全信息

安全说明: S22: 不要吸入粉尘。
S28: 接触皮肤之后, 立即使用大量皂液洗涤。
S24/25: 防止皮肤和眼睛接触。
S37/39: 使用合适的手套和防护眼镜或者面罩。

危险类别码: R20/21/22: 吸入、皮肤接触和不慎吞咽有害。

CAS#169590-42-5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. 169590-42-5](#) 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: 治疗关节炎药

1. 塞来昔布 (169590-42-5) 的生产方法:
向**甲醇**的**甲醇**溶液中, 加入**对甲基苯乙酮**的甲醇溶液, 搅拌片刻后, 加入**三氟乙酸乙酯**, 回流反应; 浓缩, 加入10%**盐酸**至pH=2~3, **乙酸乙酯**提取; 提取液干燥, 过滤, 浓缩; 剩余物和对**胂基苯磺酰胺盐**在**乙醇**中回流, 冷却, 浓缩, 用**乙酸乙酯-石油醚**重结晶, 得 塞来昔布 (169590-42-5)。
2. (1) 分子式成分

本药为口服硬胶囊，除活性成分外，尚含有一水乳糖、十二烷基硫酸钠、聚乙烯吡咯烷酮、羟甲基纤维素钠和硬脂酸镁。200mg胶囊为不透明，白色，金带标记标有7767和200字样。

(2) 制剂规格

硬胶囊：200mg/片。

(3) 药理毒理

是一种新一代的化合物，具有独特的作用机制即特异性地抑制环氧化酶-2（COX-2）。炎症刺激可诱导COX-2生成，因而导致炎症前列腺素类物质的合成和聚积，尤其是前列腺素E₂，引起炎症、水肿和疼痛。本药可通过抑制COX-2阻止炎症前列腺素类物质的产生，达到抗炎、镇痛及退热作用。

(4) 药动学

空腹给药的本药吸收良好，约2~3小时达到血浆峰浓度，胶囊口服后的生物利用度为口服混悬后生物利用度的99%（混悬液为口服利用的最佳剂型）。在整个治疗剂量范围内，本药具有线性、且与剂量成正比的药代动力学特征。本药的血浆蛋白结合率与浓度无关，在治疗血浆浓度时，血浆蛋白结合率约为97%。药物在血中并不是优先与红细胞结合。与进食（高脂食物）同时给药，则本药的延迟吸收，T_{max}延至4个小时，生物利用度增加约20%。健康受试者每日1次或分2次口服400mg本品后其生物利用度相同。而在骨关节炎患者，每日1次或分2次口服200mg本品后，其临床疗效及安全性相当。代冬和要通过细胞色素P450-CYP2C9。原形药具有药理活性，循环中其主要代谢产物未测得COX-1和COX-2抑制活性。本品的清除主要通过肝脏进行，少于1%剂量的药物以原形从尿中排出。多剂服药后清除半衰期为8~12小时，清除率约为500mL/分。连续给药5天内达到其稳态分布容积均值，约为500L/70kg，表明本药在组织中的广泛分布。临床前研究表明本药可通过血脑屏障。

(5) 适应症

急性期或慢性期骨关节炎和类风湿关节炎的症状和体征。

(6) 不良反应

主要有头痛、眩晕、便秘、恶心、腹痛、腹泻、消化不良、胀气、呕吐等。

(7) 相互作用

可与甲氨喋呤、酮康唑、抗酸剂（铝剂和镁剂）、苯妥英、格列苯脲、甲苯磺丁脲联合使用。在西乐葆和华法令或其他类似药物联合应用的头几天，或西乐葆的剂量改变后数天内，应密切监测其抗凝血作用。

(8) 用法用量

骨关节炎：西乐葆治疗骨关节炎的症状和体征推荐剂量为200mg，每日一次口服。临床研究中也曾用至每日400mg的剂量。类风湿关节炎：西乐葆治疗类风湿关节炎的症状和体征推荐剂量为100mg或200mg每日2次。临床研究中的剂量曾用至每日800mg。

老年人：不必调整剂量。

肝功能损害患者：轻至中度肝功能损害患者无需调整剂量。

肾功能损害患者：轻至中度肾功能损害患者无需调整剂量，对于重度肾功能损害患者无临床使用经验。

儿童：本药没有在18岁以下人群中进行过临床研究。

(9) 注意事项

对本产品中任何成份过敏者；已知对磺胺过敏者禁用。

本药含有磺胺基团，临床研究中哮喘病人服用西乐葆后未发生支气管痉挛。但由于未在阿司匹林或其他非甾体抗炎药诱发哮喘、荨麻疹或急性鼻炎的患者中评估西乐葆，因此，尚未有研究资料以前，此类病人应避免服用西乐葆。

妊娠期：没有关于妊娠期应用西乐葆的资料，只有潜在益处大于对胎儿的危害时，妊娠期妇女才可以考虑用西乐葆治疗。哺乳期：因没有在人体中进行类似研究，故西乐葆不应用于哺乳期妇女。

(10) 导致心血管疾病的危险性

美国国立癌症研究所（NCI）组织的一项旨在研究本药新的适应症——预防结肠腺瘤息肉（APC）的临床研究显示：与服用安慰剂的患者相比，服用本药的患者发生心血管疾病的危险性增加。

在这项临床试验中，服用本药400mg一天两次的患者，心血管疾病发生的危险性为服用安慰剂的患者3.4倍；服用本药200mg一天两次的患者，心血管疾病发生的危险性为服用安慰剂的患者2.5倍。在这项试验中，患者的平均用药时间为33个月。

NCI向美国食品药品监督管理局（FDA）报告了上述情况，2004年12月17日，FDA发表声明紧急要求暂停本药的临床试验。

据了解，西乐葆是全球第一个环氧化酶-2（COX-2）抑制剂，这类药物在缓解疼痛的同时，可以避免以往的非甾体抗炎药带来的严重的胃肠道副作用。2001年，辉瑞公司推出其第二个COX-2抑制剂Bextra（伐地考昔 valdecoxib），应用于骨关节炎和类风湿关节炎。数据显示，自COX-2抑制剂应用以来，因关节炎治疗导致的胃肠道

生产方法及其他：

副作用而住院的患者明显减少。

相关化学品信息

[16201-81-3](#) [160455-76-5](#) [1,2-环己基二甲酸二甲酯](#) [163702-19-0](#) [16051-52-8](#) [16837-14-2](#) [165820-24-6](#) [160893-95-8](#) [16322-19-3](#) [167421-51-4](#) [169376-25-4](#) [16457-30-0](#) [169248-97-9](#) [3-0-乙酰基-1,2:5,6-二-0-异丙基- \$\alpha\$ -D-呋喃\(型\)葡萄糖](#) [167875-42-5](#) [四丁基碘化铵](#) [碳酸锂](#) [碘乙酸钠](#) 543