

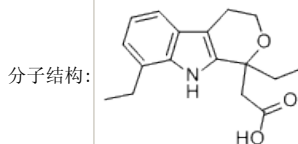


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[41340-25-4](#), 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:41340-25-4 基本信息

中文名:	依托度酸; 1,8-二乙基-1,3,4,9-四氢吡喃[3,4-b]吲哚-1-乙酸
英文名:	Etodolac
别名:	1,8-Diethyl-1,3,4,9-tetrahydropyrano[3,4-b]indole-1-acetic acid



分子式:	C ₁₇ H ₂₁ NO ₃
分子量:	287.36
CAS登录号:	41340-25-4

物理化学性质

性质描述:	白色或类白色固体。熔点145-148℃, 不能溶于水, 但能溶于水、酒精、氯仿、DMSO, 聚乙稀乙二醇水溶液。 Pka=4.65。
-------	---

安全信息

安全说明:	S22: 不要吸入粉尘。 S36: 穿戴合适的防护服装。 S45: 出现意外或者感到不适, 立刻到医生那里寻求帮助(最好带去产品容器标签)。
-------	--

危险品标:	 T: 有毒物质
-------	---

危险类别码:	R40: 有限证据表明其致癌作用。 R23/24/25: 吸入、皮肤接触和不慎吞咽有毒。
--------	---

CAS#41340-25-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

深圳迈瑞尔化学技术有限公司(代理ABCR) 专业从事41340-25-4及其他化工产品的生产销售 0755-86170099

大连美仑生物技术有限公司 依托度酸专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0411-82593631、82593920

供应商信息已更新且供应商的链接失效, 请登录爱化学 [CAS No. 41340-25-4](#) 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:	依托度酸用于消炎镇痛, 治疗骨关节炎和风湿性关节炎, 也用于治疗软组织损伤, 例如腱炎和粘液囊炎。依托度酸也能迅速的减轻一些轻微到中度的疼痛, 例如痛经。用法: 1) 一般的止痛: 每6个小时200到400毫克, 通常一天不当超过1000毫克, 但假如有绝对的必要, 医生可能会将你的剂量增加到1200毫克。2) 骨关节炎和风湿性关节炎: 罗丁开始的剂量是一天2-3次, 每次300毫克, 或者是一天2次, 每次400或500毫克。一般的日用量的限度在600到1000毫克之间, 假如有必要, 医生的处方可能会增加到1200毫克。 罗
-------	---

1. 依托度酸 (41340-25-4) 的规格: 按无水物计算, 含C ₁₇ H ₂₁ NO ₃ 不得少于98.0%和不得大于102.0%; 熔点应为144~150℃; [α] _D ²⁰ -0.10° ~ +0.10° (2.50g本品溶于25.0mL甲醇); 有关物质应符合规定; 氯化物含量不得大于0.03%; 含重金属不得大于

0.001%；含水分不得大于0.5%；硫酸盐灰分不得大于0.1%。

2. 依托度酸（41340-25-4）的生产方法：

邻乙基苯胺和三氯乙醛水合物及羟胺反应，在酰化的同时形成脒，再在硫酸催化下环合，并用氯化铝锂还原生成吡啶衍生物，和草酰氯及乙醇反应在3位引入1，2-二羰基侧链，氯化铝锂还原为羟乙基，和丙酰乙酸乙酯缩合环合，最后水解生成该产品。

3. (1) 药理作用

药效学：本品为非甾体抗炎药，具有抗炎、解热和镇痛作用。其作用机理可能是通过阻断环氧合酶的活性，从而抑制了前列腺素（PG）的合成。本品为非类固醇抗炎药（NSAIDs）。作为镇痛及消炎药，其疗效可与阿司匹林、其他镇痛药及许多目前最常用的处方用NSAIDs相比。它在炎症部位选择性地抑制前列腺素生物合成，给予大鼠治疗剂量时，对胃前列腺素PGE₂的抑制是轻微和短暂的。这可能是其胃肠道不良反应较小的机制。大鼠佐剂关节炎模型表明，本品可减少骨及关节损害的发生率和严重性，并能逆转疾病的进展。动物试验未见致畸作用，对生育及一般生殖功能有较小影响。但妊娠动物试验表明抑制前列腺素生物合成的药物可引起难产及分娩延迟。某些前列腺素生物合成的抑制剂可干扰动脉导管的闭合。

(2) 药代动力

据国外文献报导，口服给药吸收良好，没有明显的首过效应，全身生物利用度达80%或以上。每12小时给药在600mg以内时，血药浓度一时间曲线下面积与给药剂量成正比关系。99%以上的本药与血浆蛋白结合，游离部分少于1%。单剂量给药200-600mg，在80±30分钟内其平均血浆峰值浓度（C_{max}）介于14±4-37±9μg/ml范围内。其平均血浆清除率为47（±16）ml/hr/kg，清除半衰期为7.3（±4.0）小时。本药经肝脏代谢，16%的给药剂量经粪便排泄。通常不根据体重决定给药剂量，但在推荐剂量

(3) 适应症

缓解骨关节炎（退行性关节病变），类风湿性关节炎的症状和体征。缓解疼痛症状。类风湿性关节炎，包括该病特有的骨缺损（侵蚀），关节腔狭窄，骨关节炎（变性关节疾病）及轻至中度的疼痛。

(4) 用法用量

止痛：急性疼痛的推荐剂量为0.2-0.4g，每8小时一次，每日最大剂量不超过1.2g。体重在60公斤以下者，每日最大剂量不应超过20mg/公斤体重。在一些病人中本药仍有止痛作用。慢性疾病：如骨关节炎、类风湿关节炎：推荐剂量为每日0.4-1.2g，分次口服，每日最大剂量不应超过1.2g，体重在60公斤以上者，每日最大剂量不应超过20mg/公斤体重。本药的剂量在每日0.4g以下，分次口服，或每晚剂量给药0.4g或0.6g，在一些病人中有一定的疗效。

(5) 不良反应

国外资料报导了对2629例关节炎病人在开放、双盲的临床验证中观察4-320周的结果以及世界范围内的大约6万病人在该药物上市后的监测结果，上市后的自发性报道也包含在其中。临床研究显示，该药总的耐受性较好，大多数不良反应轻微而且短暂。以下不良反应认为可能与药物有关。发生率>1%：全身症状：腹痛、乏力、不适、寒战、发热。消化系统：便秘、腹泻、消化不良、腹胀、胃炎、黑便、恶心、呕吐。神经系统：焦虑、抑郁、头晕。皮肤及附属器：瘙痒、皮疹。特殊感觉：视物模糊、耳鸣。泌尿系统：排尿困难、尿频。

(5) 禁忌症

有活动期消化性溃疡或与应用另一种非甾体抗炎镇痛药有关的胃肠溃疡或出血史者禁用。不同非甾体抗炎镇痛药之间可能存在交叉反应，因此在阿司匹林或其他非甾体抗炎镇痛药治疗期间出现哮喘、鼻炎、荨麻疹或其他过敏反应者，以及对本品过敏者禁用。

4. 对水是稍微有危害的不要让未稀释或大量的产品接触地下水、水道或者污水系统，若无政府许可，勿将材料排入周围环境。

5. ①疏水参数计算参考值（XlogP）：2.8；

②氢键供体数量：2；

③氢键受体数量：3；

④可旋转化学键数量：4；

⑤拓扑分子极性表面积（TPSA）：62.3；

⑥重原子数量：21。

6. 常规情况下不会分解，没有危险反应。

密封、在2℃~8℃下保存。

7. (1) 鉴别

①取本品的细粉适量（约相当于本药0.5g），加正己烷30ml，振摇5分钟，离心，弃去澄清的正己烷液，残留物中加乙醚40ml，振摇5分钟，滤过，滤液通氮气干燥，残渣中加0.1mol/L盐酸溶液约5ml，置水浴上温热并用玻棒搅拌至

生产方法及其他:

析出结晶，冰浴中冷却。滤过，在60℃真空干燥1小时，结晶的红外光吸收图谱应与本药对照品的图谱一致。

②在含量测定项下记录的色谱图中，供试液中主峰的保留时间应与对照液中本药峰的保留时间一致。

(2) 检查

①有关物质：取本品的细粉适量（约相当于本药0.2g），加丙酮20ml，振摇，超声5分钟使本药溶解，滤过，取续滤液作为供试品溶液；精密量取1ml，置200ml量瓶中，用丙酮稀释至刻度，摇匀，作为对照溶液（1）；再精密量取对照溶液（1）5ml，置10ml量瓶中，用丙酮稀释至刻度，摇匀，作为对照溶液（2）。照薄层色谱法试验，吸取上述三种溶液各10 μ l，分别点于经预处理的同一硅胶GF<[254]>薄层板上[薄层板预先在2.5%抗坏血酸溶液-甲醇（20:80）展开剂中上行到薄层板点样线以上1cm，取出薄层板，干燥30分钟以上]，以冰醋酸-无水乙醇-甲苯（0.5:30:70）为展开剂，展开后，晾干，置紫外光灯（254nm）下检视。供试品溶液如显杂质斑点，其颜色不得深于对照溶液（2）主斑点所显颜色。

②甲基同系物：照高效液相色谱法测定。色谱条件与系统适用性试验：用十八烷基硅烷键合硅胶为填充剂，乙腈-甲醇-1.74%磷酸氢二钾溶液（13:19:68）为流动相，检测波长为225nm，本药的1-甲基同系物与8-甲基同系物峰的分度度不小于0.75。

③测定法：取本品的细粉适量（约相当于本药0.1g），精密称定，置100ml量瓶中，加甲醇40ml，振摇，超声5分钟使本药溶解，加水至刻度，摇匀，滤过，精密量取续滤液10ml，置20ml量瓶中，加水稀释至刻度，摇匀，作为供试品溶液；另取本药的1-甲基同系物对照品与8-甲基同系物对照品各25mg，置100ml量瓶中，加甲醇40ml溶解，用水稀释至刻度，摇匀，精密量取5ml，置250ml量瓶中，加水稀释至刻度，摇匀，作为对照品溶液。精密量取对照品溶液和供试品溶液各20 μ l，分别注入色谱仪中，记录色谱图，按外标法以峰面积计算。含本药的1-甲基同系物和8-甲基同系物的总量不得大于1.0%。

④溶出度：取本品，照溶出度测定法，以磷酸盐缓冲液（pH7.5）（取0.2mol/L磷酸二氢钾溶液250ml，用0.2mol/L氢氧化钠溶液调节pH值至7.5，加水稀释至1000ml）900ml为溶剂，转速每分钟100转，依法操作，经45分钟时，取溶液适量，滤过，精密量取续滤液适量，加上述溶剂定量稀释制成每1ml中约含12 μ g的溶液作为供试品溶液；另精密称取本药对照品适量，加上述溶剂定量稀释制成每1ml中约含12 μ g的溶液作为对照品溶液。取上述两种溶液，照分光光度法，在278nm波长处分别测定吸收度，计算每片的溶出量，限度为标示量的70%，应符合规定。⑤其他：应符合片剂项下有关的各项规定。

(3) 含量测定

①照高效液相色谱法测定。色谱条件与系统适用性试验：用十八烷基硅烷键合硅胶为填充剂，乙腈-磷酸盐缓冲液（取0.5mol/L磷酸二氢钾溶液100ml）（45:55）为流动相，检测波长为225nm，取0.05%本药对照品的0.1mol/L氢氧化钠溶液和本药的1-甲基同系物的0.1mol/L氢氧化钠溶液各2ml，混合，用流动相稀释至100ml，摇匀，进样分析。本药峰和本药的1-甲基同系物峰的分度度应不小于1.5。

②测定法：取本品20片，精密称定，研细，精密称取适量（约相当于本药50mg），置100ml量瓶中，加0.1mol/L氢氧化钠溶液70ml，振摇30分钟使溶解，加0.1mol/L氢氧化钠溶液至刻度，摇匀，滤过，精密量取续滤液2ml，置100ml量瓶中，用流动相稀释至刻度，摇匀，精密量取20 μ l注入液相色谱仪，记录色谱图；另取本药对照品适量，用0.1mol/L氢氧化钠溶液溶解并定量稀释制成每1ml中含0.5mg的溶液，精密量取2ml，置100ml量瓶中，用流动相稀释至刻度，摇匀，同法测定，按外标法以峰面积计算，即得。

相关化学品信息

[41743-86-6](#) [2,6-二叔丁基-4-乙基苯酚](#) [41003-94-5](#) [4131-84-4](#) [2-溴-6-氯己酰氯](#) [41204-65-3](#) [41411-64-7](#) [419573-20-9](#) [三\[3,5-二\(1,1-二甲基乙基\)-2-羟基苯甲酸根-01,02\]铝](#) [3,5-二\(1,1-二甲基乙基\)-2-羟基苯甲酸-铝配合物](#) [2-甲基二甲氨基氯化物](#) [41636-35-5](#) [41343-21-9](#) [4160-19-4](#) [3-甲基-4-磷酰丁烯酸三乙酯](#) [41691-92-3](#) [苹果酸](#) [间苯二甲腈](#) [溴乙酸乙酯](#) 561