



本PDF文件由 www.ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击 [72492-12-7](#), 若要查询其它化学品请登录 [CAS号查询网](#)

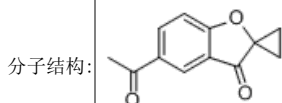
如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](http://www.ichemistry.cn)

CAS Number:72492-12-7 基本信息

中文名: 螺佐呋酮;
螺佐呋酮;
5-乙酰螺[苯并呋喃-2(3H),1'-环丙烷]-3-酮

英文名: Spiro[benzofuran-2(3H),1'-cyclopropan]-3-one,5-acetyl-

别名: AG 629;
Maon;
Spizofurone



分子式: C₁₂H₁₀O₃

分子量: 202.206

CAS登录号: 72492-12-7

物理化学性质

性质描述: 螺佐呋酮(72492-12-7)的化学性质:
从乙醇结晶, 熔点102~104℃; 106~107℃。
急性毒性LD₅₀雄、雌小鼠, 雄、雌大鼠(mg/kg): 1810, 1740, 5630, 5640口服。

CAS#72492-12-7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. 72492-12-7 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: 螺佐呋酮(72492-12-7)的用途:
用于胃溃疡。

生产方法及其他: 螺佐呋酮(72492-12-7)的生产方法:
在室温和搅拌下, 将5-乙酰基-2-羟基苯甲酸甲酯(8.0mol)加到1.32kg碳酸钾在2.0L二甲基甲酰胺的悬浮中。在60℃加热1h后, 在5℃和3h内加入1.32kg α-溴-γ-丁内酯。加毕在45℃下搅拌10h。冷却, 过滤除去不溶的无机物。滤液减压浓缩, 剩余物真空蒸馏以移去没有反应的5-乙酰基-2-羟基苯甲酸甲酯。剩余物(粗品化合物(I)), 用甲醇重结晶后, 熔点112~113℃)溶于2L甲醇和2L 50%氢氧化钠水溶液。并于60℃加热。冷却后, 将反应液倾入1.5L冰水, 用2.2L浓盐酸酸化。过滤收集析出的沉淀, 水洗, 干燥。溶于1L二氧六烷和1L甲苯。加入400g对甲苯磺酸, 在装有分水器的装置中加热回流8.5h。减压浓缩, 剩余物倾入10L冰水。过滤收集析出的沉淀, 水洗, 干燥, 溶于乙酸乙酯。干燥后浓缩, 用丙酮-甲醇重结晶, 得化合物(II), 总收率45%, 熔点155~158℃。

1.26mol化合物(II)在2.8L乙酐的溶液和560ml三乙胺加热回流。减压浓缩, 剩余物倾入3L冰水。过滤收集析出的沉淀, 洗涤后, 用甲醇重结晶, 得化合物(III), 收率55%, 熔点132~134℃。

7.4mol化合物(III)和94g氯化钠溶于1.5L二甲亚砜, 在150℃下搅拌1.5h。冷却后, 倾入冰水。过滤收集析

出的沉淀，水洗，干燥，用乙醇重结晶，得螺佐咪酮，收率88%，熔点。102~104℃。

从化合物(I)也可直接得到化合物(III)。化合物(I) (4.7mmol)在15ml乙酸酐的溶液和3ml三乙胺加热回流10h。减压浓缩，剩余物倾入冰水，用乙酸乙酯提取。提取液水洗，干燥，减压浓缩。剩余物用硅胶层析，四氯化碳-丙酮(5:1, 体积比)洗脱。收集第二组分洗脱液，用甲醇重结晶，得化合物(III)，收率47%。

一步合成法。以5-乙酰基-2-[(四氢-2-氧-3-咪喃基)氧]苯甲酸甲酯(化合物(I))为原料，可一步反应得到螺佐咪酮，但对试剂要求较高。

将4.17g1, 5-二氮双环[5.4.0]十一烯-5(DBU)和67g氯化钠溶于1L二甲基甲酰胺，在150℃和搅拌下，于2h内滴加5-乙酰基-2-[(四氢-2-氧-3-咪喃基)氧]苯甲酸甲酯(278g, 1mol)在1.8L二甲基甲酰胺的溶液，加毕再搅拌2h。减压蒸去溶剂，剩余物用水稀释后，用二氯甲烷提取。提取液洗涤，干燥，通过硅胶进行脱色。二氯甲烷溶液减压浓缩，产生的结晶再用乙醇重结晶，得136g螺佐咪酮，收率67%，熔点106-107℃。

螺佐咪酮(72492-12-7)的药理作用:

本品为粘膜防御型胃溃疡治疗药。能使胃粘膜血流量增加，促进胃粘膜合成前列腺素E₂。抑制阿司匹林或乙醇引起的胃粘膜电位差下降及酸向胃粘膜逆向扩散。能抑制乙醇、酸及碱引胃粘膜损伤。

螺佐咪酮(72492-12-7)的药代动力:

血药浓度: 健康成人3例饭后口服本品80mg, 血中未能检出原药, 主要代谢物有M-I(原药中5-2乙酰基氧化成羧基)及M-V(5-乙酰基变成羧基甲基), 达峰时间分别为1.98及1.69h, 峰药浓度为1330及1540ng/ml, 半衰期为5.41及0.89h, 曲线下面积(AUC)为6500及5010 μg/(L.hh)。排泄: 健康成人饭后口服本品80mg, 从尿中排出迅速, 尿中未检出原药, 可检出主要代谢物M-I及M-V, 24h内经尿排出迅速, 尿中未检出原药, 可检出主要代谢物M-I及M-V, 24h内经尿排出约80%

螺佐咪酮(72492-12-7)的适应症:

胃溃疡。

螺佐咪酮(72492-12-7)的用法用量:

口服, 成人每次80mg, 3次/d, 饭后服。可增加至4次/d。

螺佐咪酮(72492-12-7)的不良反应:

总发生率3.24% (17/524)。其中有恶心、胃部不适感、腹部饱胀感、便秘、软便等消化系统症状12例, SGOT、SGPT上升等肝功能异常3例, 瘙痒感2例。

螺佐咪酮(72492-12-7)的注意事项:

出现瘙痒感等过敏症状时应终止给药。

孕妇、小儿用药的安全性尚未确定。

动物试验中见本品可移行至母乳中, 服药期间应避免授乳。

相关化学品信息

[72596-02-2](#) [720692-77-3](#) [72269-92-2](#) [7225-66-3](#) [72361-41-2](#) [72928-35-9](#) [72190-37-5](#) [72036-29-4](#) [72453-57-7](#)
[72428-93-4](#) [72018-27-0](#) [N-SUCCINIMIDYL 7-MALEIMIDOHEPTANOTE](#) [72678-82-1](#) [726201-98-5](#) [728919-12-8](#) 462

生成时间2021/5/24 10:33:34