

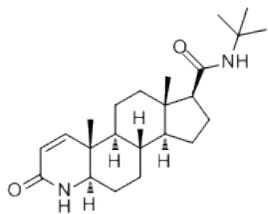
本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击98319-26-7, 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:98319-26-7 基本信息

| | |
|------|---|
| 中文名: | 非那雄胺; N-叔丁基-3-氧代-4-氮杂-5a-雄甾-1-烯-17b-甲酰胺 |
| 英文名: | Finasteride |
| 别名: | N-(2-methyl-2-propyl)-3-oxo-4-aza-5alpha-androst-1-ene-17beta-carboxamide; Proscar |

分子结构:

分子式: $C_{23}H_{36}N_2O_2$

分子量: 372.54

CAS登录号: 98319-26-7

物理化学性质

水溶性: 不溶

非那雄胺(98319-26-7)的化学性质:
白色或类白色结晶性固体。

性质描述: 易溶于**氯仿**、二甲亚砜、**乙醇**、**甲醇**或**正丙醇**, 难溶于丙二醇或**聚乙二醇400**, 极微溶于0.1mol/L**盐酸**、0.1mol/L**氢氧化钠溶液**或**水**。

熔点约257℃; 也有熔点252~254℃。

$[\alpha]_D^{25} -59^\circ$ (C=1, 甲醇)。

安全信息

安全说明: 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)。
S53: 避免暴露——使用前先阅读专门的说明。
S36/37/39: 穿戴合适的防护服、手套并使用防护眼镜或者面罩。

危险品标:



T: 有毒物质

危险类别码: R22: 吞咽有害。
R60: 可能降低生殖能力。
R61: 可能对未出生的婴儿导致伤害。

CAS#98319-26-7化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

梯希爱(上海)化成工业发展有限公司 专业从事98319-26-7及其他化工产品的生产销售 800-988-0390
深圳迈瑞尔化学技术有限公司(代理ABCR) 非那雄胺专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0755-86170099

阿达玛斯试剂 长期供应N-叔丁基-3-氧代-4-氮杂-5a-雄甾-1-烯-17b-甲酰胺等化学试剂, 欢迎垂询报价 400-111-6333

阿凡达化学 生产销售C23H36N2O2等化学产品, 欢迎订购 400-615-9918

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. 98319-26-7 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: 男子前列腺肥大及秃发。

非那雄胺(98319-26-7)的生产方法:

以孕烯醇酮为原料。先和吡啶作用, 再和甲酸钠反应得3-羟基-5-雄甾烯-17 β -羧酸甲酯(III)。再和异丙醇铝在甲苯和环己酮中, 回流。过滤, 洗涤, 干燥, 减压浓缩。加入石油醚, 于5 $^{\circ}$ C搅拌, 抽滤得氧化产物(IV), 收率74.6%。该氧化产物和95%乙醇及10%氢氧化钾溶液, 在氮气保护下回流。减压蒸去乙醇后, 用6mol/L盐酸调至Ph值约为3。抽滤, 滤饼用水洗至中性, 干燥得水解产物(V), 收率96.4%。

水解产物溶于叔丁醇中, 搅拌下加入无水碳酸钠的水溶液, 回流下滴加高碘酸钠和高锰酸钾的水溶液, 加毕回流。冷却, 过滤。滤液减压蒸去大部分叔丁醇后, 冰浴下用6mol/L盐酸调至Ph值约为2。乙酸乙酯提取, 提取液用饱和氯化钠洗, 干燥。减压蒸干, 乙酸乙酯重结晶得开环产物(VI), 收率66%。在冰浴冷却下, 往乙二醇中通入氨气, 加入开环产物, 缓慢升至180 $^{\circ}$ C反应。冷却, 加水, 用6mol/L盐酸调至Ph值约为2。滤集固体, 水洗至中性, 用二甲基甲酰胺重结晶, 得环合产物(VII), 收率62.1%。该环合产物和二氧化铂、醋酸及少量高氯酸, 在85 $^{\circ}$ C和常压下氧化。滤去催化剂后, 减压浓缩至干。残留物用二甲基甲酰胺重结晶, 得氢化产物(VIII), 收率92.9%。

该氢化产物和三苯基膦、甲苯及2, 2'-二吡啶二硫化物(DPDS)混合, 室温搅拌。柱层析分离得吡啶硫化物(IX), 收率79.0%。该硫化物和无水四氢呋喃及叔丁胺, 室温搅拌过夜, 加入二氯甲烷, 用2mol/L盐酸和饱和氯化钠洗, 干燥, 减压浓缩。残留物用乙酸乙酯重结晶, 得酰胺产物(X), 收率77.1%。该酰胺和苯亚硒酸酐及氯苯一起, 回流并缓慢蒸出溶剂和生成的水。柱层析分离, 粗品用乙酸乙酯重结晶, 得白色的非那雄胺晶体, 收率52.3%, 熔点253~255 $^{\circ}$ C。

非那雄胺(98319-26-7)的功用作用:

非那雄胺为一种4-氮杂甾体化合物, 它是睾酮代谢成为更强的二氢睾酮过程中的细胞内酶-II型5 α -还原酶的特异性抑制剂。而良性前列腺增生或称作前列腺肥大取决于前列腺内睾酮向二氢睾酮的转化。本药能非常有效地减少血液和前列腺内的二氢睾酮。非那雄胺对雄激素受体没有亲和力。

在一项本药长期疗效和安全性研究中, 对有中度至严重前列腺增生症状的3016名服用4年本药的患者前列腺增生相关的泌尿系统处置, 如经尿道切除前列腺和其他前列腺切除术, 或需插入导尿管的急性尿潴留进行了评价。在这项双盲、随机、安慰剂对照的多中心研究中, 用本药治疗使泌尿系统处置的总体危险性降低了51%, 并伴有显著且持续的前列腺体积缩小, 以及持续的最大尿流速增高和症状改善。

非那雄胺(98319-26-7)的用法用量:

口服, 5mg/次, 1次/日, 6个月为1疗程。5mg/日, 饭前、饭后均可服用。肾功能不全患者 对各种肾功能程度不全患者, 不需调整剂量。老年人70岁以上患者药代动力学研究显示, 非那雄胺的清除率有所降低, 但不需调整剂量。

非那雄胺(98319-26-7)的注意事项:

妇女、儿童和对本品过敏者禁用。

对于有大量残留尿和/或严重尿流减少的患者, 应密切监测其尿路梗阻的情况。

非那雄胺(98319-26-7)的药理作用和毒性研究:

药理作用: 非那雄胺是4-氮杂甾体激素化合物, 为特异性II型5 α -还原酶抑制剂, 抑制外周睾酮转化为二氢睾酮, 降低血液和前列腺、皮肤等组织中二氢睾酮水平。前列腺的生长发育和良性增生依赖于二氢睾酮, 非那雄胺通过降低血液和前列腺组织中的二氢睾酮水平而抑制前列腺增生、改善良性前列腺增生的相关临床症状。

生产方法及其他:

毒性研究:

1. 遗传毒性: 体外细菌、哺乳动物细胞突变试验及体外碱性洗脱试验结果均未显示出致突变作用。体外CHO细胞染色体畸变研究中, 非那雄胺在450~550 μ mol浓度下, CHO细胞染色体畸变率轻度增加, 该浓度相当于口服本品5mg后血浆峰浓度的4000~5000倍。体内染色体畸变试验中, 小鼠给予非那雄胺250mg/kg/天(按AUC计, 相当于人临床推荐日用剂量5mg的228倍, 下述所有毒理研究剂量的计算方法相同), 染色体畸变没有升高。

2. 生殖毒性: 非那雄胺80mg/kg/天, 连续给药12周对性成熟雄兔和雄性大鼠的生育力没有影响。当大鼠持续24周以上给予非那雄胺80mg/kg/天时, 导致其精囊和前列腺的重量也显著减轻, 交配时精栓形成失败从而使大鼠生育力下降; 但对大鼠和兔的睾丸及交配行为没有影响; 上述毒性效应在停药后6周内恢复。

非那雄胺(98319-26-7)对前列腺特异抗原及前列腺癌检查的影响:

目前为止, 用本药治疗前列腺癌患者还未见临床疗效。在对照的临床研究中, 通过系列PSAs和前列腺活检, 对前列腺增生和前列腺特异抗原升高的患者进行监测。在这些研究中, 本药未改变前列腺癌的检测率, 且使用本药与使用安慰剂的患者前列腺癌的总发病率没有显著差异。

建议在接受本药治疗前及治疗期间, 应定期做直肠指检, 以及其它的前列腺癌检查。血清PSA也用于前列腺癌的检查。一般来说, 基线PSA超过10纳克/毫升则提示应进一步检查并考虑活检。PSA在4-10纳克/毫升之间者, 建议做进一步检查。在患有或未患有前列腺癌的男性中, PSA水平存在一定的重叠。因此, 患前列腺增生的男性, 不管是否服用本药, 若PSA值在正常参考范围内, 并不能排除前列腺癌的可能性。基线PSA小于4纳克/毫升者, 也不能排除前列腺癌。

即使伴有前列腺癌, 本药可使前列腺增生患者的血清PSA浓度大约降低50%。在评价PSA数据, 且不排除伴有前列腺癌时, 应考虑到本药会使前列腺增生患者的血清PSA水平降低。虽然患者有个体差异, 其PSA数值降低的程度是可预测的。对来自3000多名患者的双盲、安慰剂对照的4年期本药长期疗效和安全性研究的PSA数据的分析证明, 典型患者服用本药治疗6个月或更长, 与未经治疗的男性正常PSA值比较, 其PSA值应该加倍。这种调整不但保留了PSA检测的灵敏性和特异性, 而且保持它检查前列腺癌的效能。

应谨慎评价使用非那雄胺治疗的患者的PSA水平持续增高, 包括考虑本药治疗的不遵从性。

对PSA水平的影响 血清PSA浓度与患者的年龄和前列腺体积有关, 而前列腺体积又与患者的年龄有关。当评价PSA实验室测定结果时, 应考虑接受本药治疗的患者PSA水平降低的事实。大多数患者在治疗的第一个月内PSA迅速降低, 随后PSA水平稳定在一个新的基线值上。治疗后基线值约为治疗前基线值的一半。因此, 用本药治疗6个月或更长时间的患者, 在与未经治疗男性的正常PSA值相比较时, PSA值应该加倍。

对妊娠和哺乳的影响 本药禁用于怀孕和可能怀孕的妇女。由于包括非那雄胺在内的II型5 α -还原酶抑制剂具有抑制睾酮转化为二氢睾酮的作用, 当怀孕妇女服用后, 可引起男性胎儿外生殖器异常。由于存在吸收非那雄胺后, 继而对男性胎儿产生危险的可能性, 当服用怀孕或可能受孕时, 不应触摸本药的碎片和裂片, 避免接触其活性成分。

非那雄胺(98319-26-7)在脱发领域的应用:

非那雄胺是一种合成的甾体类化合物, 它是雄激素睾酮代谢成为双氢睾酮过程中的细胞内酶II型5 α 还原酶的特异性抑制剂。非那雄胺对雄激素受体没有亲和力, 也没有雄激素样、抗雄激素样、雌激素样、抗雌激素样或促孕作用。对该酶的抑制能阻碍外周组织中睾酮象雄激素双比, 可使血循环中睾酮的水平升高约10~15%, 但仍在生理范围内。非那雄胺能使血清中双氢睾酮浓度迅速下降, 在给药24小时内使之显著减少。

毛囊内含有II型5 α -还原酶, 在男性秃发患者的秃发区头皮内毛囊变少, 并且双氢睾酮增加。给予非那雄胺可使这些患者头皮及血清中的双氢睾酮浓度下降。先天性缺乏II型5 α -还原酶的男子不会患男性秃发。这些资料以及临床研究的结果证实非那雄胺能抑制头皮毛囊变小, 逆转脱发过程。

相关化学品信息

[4-\(4-羟基苯基\)-1,2,4-三唑](#) [糠醇](#) [4-羟基苯磺酸](#) [2-溴甲基-3-硝基苯甲酸甲酯](#) [2,6-二碘嘌呤](#) [5-乙基-2-\[4-反\(4-丙基环己基\)苯基\]噻](#)
[啉](#) [胆磷胆碱](#) [苯基三甲基碘化铵](#) [橡胶促进剂PPD](#) [3,5-二氨基-4-甲基苯磺酸](#) [2-\[\(1-乙酰基-2-氧代丙基\)硫\]-N-环己基-1H-苯并咪唑-1-甲](#)
[酰胺](#) [苯基三氯硅烷](#) [D-山梨醇](#) [干扰素alpha-2b](#) [98897-09-7](#) [邻苯](#) [氯化钇](#) [甲酸甲酯](#) 507