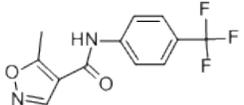


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[75706-12-6](#), 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:75706-12-6 基本信息

中文名:	来氟米特; 5-甲基-N-[4-(三氟甲基)苯基]-4-异噁唑甲酰胺
英文名:	Leflunomide
别名:	5-Methylisoxazole-4-(4-trifluoromethyl)carboxanilide
分子结构:	
分子式:	C ₁₂ H ₉ F ₃ N ₂ O ₂
分子量:	270.21
CAS登录号:	75706-12-6

物理化学性质

熔点:	163-168℃
性质描述:	来氟米特 (75706-12-6) 的性质: 1. 白色或类白色结晶性粉末; 2. 25℃溶于水25~27mg/L, 溶于 甲醇 、 乙醇 、 丙酮 ; 3. 熔点166.5℃, pK _a 10.8。

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。
危险品标:	 H302: 有害物质
危险类别码:	R22: 吞咽有害。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#75706-12-6化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

 Sigma-Aldrich 专业从事75706-12-6及其他化工产品的生产销售 800-736-3690
 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. 75706-12-6 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:	来氟米特 (75706-12-6) 氢化乳清酸脱氢酶抑制剂, 具有免疫抑制和抗炎作用, 用于治疗成人活动性类风湿性关节炎。
	1. 来氟米特 (75706-12-6) 的生产方法: ①乙酰乙酸乙酯、原甲酸三乙酯和酞酰一起回流至原料完全反应, 约5h。蒸馏收集140~150℃/1.87kPa的馏分, 得化合物(I), 收率85%。 ②化合物(I)溶于无水乙醇, 在10~15℃和1h中滴加盐酸羟胺、乙酸钠和水的混合液。滴毕再反应约8h。加入浓盐酸和冰乙酸, 回流5h。减压浓缩至1/2体积, 冷却至10℃以下, 过滤, 乙醇-水重结晶, 得化合物(II), 为白色结晶粉末, 熔点145~146.5℃, 收率80%。 ③化合物(II)溶于甲苯, 在50~55℃滴加氯化亚砷, 回流3h。浓缩, 分馏, 收集78~79℃/1.87kPa的馏分,

得化合物(III), 收率75%。

④对三氟甲基苯胺和三乙胺溶于二氯甲烷, 在0~5℃滴加化合物(III)。再在25~30℃反应3h。加水, 分出有机层, 水洗, 饱和食盐水洗, 干燥。减压浓缩至1/3体积, 加入石油醚, 冷却, 过滤, 乙酸乙酯重结晶, 得白色结晶粉末的本品, 熔点166~167℃, 收率81%。

2. (1) 说明: 10mg/片, 双铝包装。本品为白色薄膜衣片, 除去薄膜衣呈白色。储藏温度25℃: 允许范围15~30℃, 避光。

(2) 功用作用: 本药是一个具有抗增生作用的异噁唑类免疫抑制剂其作用机理主要是抑制二氢乳清酸脱氢酶的活性, 从而影响活化淋巴细胞的嘧啶合成。体内外试验表明本品具有抗炎作用。本药的体内活性主要通过其活性代谢产物而产生。成人活动性类风湿性关节炎。

生产方法及其他: (3) 用法用量: 每日一次, 每次2片。最初三天给予负荷剂量(50mg/日), 之后给予维持剂量20mg/天。

(4) 注意事项

1、临床试验发现本药可引起一过性的SGPT升高和白细胞下降, 服药初始阶段应定期检查SGPT和白细胞。检查间隔视病人情况而定。

2、严重肝脏损害和明确的乙肝或丙肝血清学指标的患者慎用。用药前及用药后每月检查SGPT, 检测时间间隔视病人具体情况而定。

3、免疫缺陷、未控制的感染、活动性胃肠道疾病、肾功能不全、骨髓发育不良的患者慎用。

4、准备生育的男性应该考虑中断治疗, 同时服药消胆胺。

5、如果剂量过大或出现毒性时, 可给予消胆胺或活性炭快速降低M1浓度。

3. 通常对水是不危害的, 若无政府许可, 勿将材料排入周围环境。指定条件下稳定, 远离氧化物。存放在密封容器内, 并放在阴凉, 干燥处。2-8℃保存。

4. ①疏水参数计算参考值(XlogP): 2.5;

②氢键供体数量: 1;

③氢键受体数量: 6;

④可旋转化学键数量: 2;

⑤拓扑分子极性表面积(TPSA): 55.1;

⑥重原子数量: 19。

相关化学品信息

[4-羟基-2,6-二甲基苯甲酸](#) [7548-13-2](#) [2-氯-6-氟苯乙腈](#) [75867-44-6](#) [756418-31-2](#) [75871-97-5](#) [75400-64-5](#) [751424-21-2](#) [7511-74-2](#) [7526-45-6](#) [7512-78-9](#) [758699-17-1](#) [75653-86-0](#) [7570-49-2](#) [富马酸酯单异丙基酯](#) [四氧化三钴](#) [吡咯烷](#) [异丙醇](#) 495