

本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[158966-92-8](#), 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](#)

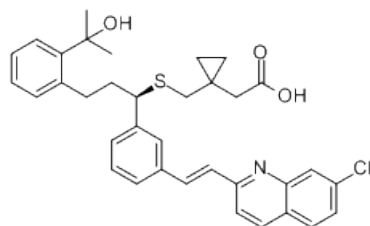
CAS Number:158966-92-8 基本信息

中文名: 孟鲁司特;
(R-(E))-1-(((1-(3-(2-(7-氯-2-喹啉基)乙烯基)苯基)-3-(2-(1-羟基-1-甲基乙基)苯基)丙基)硫)甲基)

英文名: Montelukast

别名: (R-(E))-1-(((1-(3-(2-(7-Chloro-2-quinolinyl)ethenyl)phenyl)-3-(2-(1-hydroxy-1-methylethyl)phenyl)propyl)thio)methyl)cyclopropaneacetic acid;
2-[1-[[[(1R)-1-[3-[(E)-2-(7-Chloroquinolin-2-yl)ethenyl]phen

分子结构:



分子式: $C_{35}H_{36}ClNO_3S$

分子量: 586.18

CAS登录号: 158966-92-8

CAS#158966-92-8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. 158966-92-8](#) 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:

孟鲁司特(158966-92-8)的用途:
止喘药。
选择性白细胞三烯D₄受体拮抗剂。

孟鲁司特(158966-92-8)的生产方法:

3-[2-(7-氯-2-喹啉基)乙烯基]苯甲醛溶于甲苯, 在0℃缓慢加入乙烯基溴化镁的甲苯/THF溶液, 加毕, 在此温度搅拌1h。缓慢加入饱和氨水, 再加入水和乙酸。乙酸乙酯萃取, 萃取液经水和饱和食盐水洗, 干燥, 浓缩, 剩余物经提纯后, 再经乙酸乙酯/己烷重结晶, 得化合物II。

化合物II、LiOAc/2H₂O、LiCl、Pd(OAc)₂和邻溴苯甲酸甲酯悬浮于DMF中, 在95℃搅拌4h。冷却至室温, 加入水。用乙酸乙酯萃取产物, 萃取液经干燥后浓缩, 剩余物溶于甲苯, 用硅胶过滤。经乙酸乙酯-己烷重结晶, 得化合物III, 收率86%。

在-25℃, 往(-)-B-chlorodiisopinocampheylborane (CDIB)的THF溶液中, 滴加化合物III的THF溶液, 滴毕在15℃搅拌过夜。在搅拌下倾入冰水中, 过滤收集沉淀, 经水和乙酸乙酯洗后, 在二氯甲烷和6%二乙胺的水溶液之间进行分配。分出有机层, 经食盐水洗, 干燥, 浓缩。加入甲醇, 再在剧烈搅拌下缓慢加入水, 使析出结晶。过滤收集, 得化合物IV, 收率65%。

化合物IV溶于甲苯, 在0℃缓慢加入MeMgBr的甲苯-THF溶液, 加毕在室温搅拌4h。倾入冷的12%乙酸铵水溶液中, 再加入乙酸。用乙酸乙酯萃取, 萃取液经食盐水洗后干燥, 浓缩。剩余物经提纯, 得化合物V, 收率62%。

化合物V溶于二氯甲烷，加入叔丁基二甲基氯化硅、咪唑和4-二甲氨基吡啶，在室温搅拌3天。然后加入甲苯，经层析提纯后得化合物VI。

化合物VI溶于二氯甲烷，加入二氢吡咯和三苯基溴化磷，回流1d。加入甲苯，经层析提纯后得化合物VII。

化合物VII溶于无水THF，在0℃缓慢加入四丁基氟化铵的THF溶液，所成溶液在冰箱中放置过夜，然后在室温放置4h。加入25%的乙酸铵水溶液，用乙酸乙酯萃取。萃取液经干燥后，层析提纯，得化合物VIII，从化合物V计的三步总收率为81%。

化合物VIII溶于二氯甲烷，在-40℃加入甲磺酰氯和三乙胺，在-40℃搅拌30min，再在0℃搅拌1h。加入饱和碳酸氢钠溶液，用二氯甲烷萃取。萃取液干燥，浓缩，剩余物含化合物IX直接用于下步反应。

化合物X溶于乙腈，滴加水合肼，在0℃搅拌1h。维持在0℃，将其加到化合物IX和Cs2CO3在乙腈的溶液。所成溶液在室温加热5h后，加入水。用乙酸乙酯萃取，萃取液经食盐水洗后干燥。浓缩，层析提纯，得化合物XI，收率89%。

化合物XI和对甲苯磺酸吡啶盐溶于甲醇-THF的混合溶液，在60℃加热过夜。蒸出大部分甲醇，加入氯化铵水溶液，用乙酸乙酯萃取。萃取液用食盐水洗，干燥，浓缩。剩余物经硅胶提纯，得到的固体溶于甲醇-THF混合溶液，冷至0℃，加入氢氧化钠水溶液，在室温搅拌2天。蒸出大部分甲醇，用乙酸酸化至Ph=5。加入氯化铵水溶液，用乙酸乙酯萃取。萃取液经食盐水洗，干燥。浓缩后，经层析提纯，得莫特司特，收率87%。

将莫特司特溶于乙醇，加入等量的1mol/L。氢氧化钠。浓缩，剩余的油状物溶于水，冷冻-干燥得莫特司特单钠盐。

孟鲁司特(158966-92-8)的概述：

加拿大Manitoba 大学Allan医师等的一项多中心双盲双安慰剂对照研究表明，与倍氯米松(皮质类固醇)吸入治疗不同，孟鲁司特(白三烯受体拮抗剂)对青春期前哮喘患儿身高的增长无显著影响。

研究纳入的360例轻度持续哮喘患儿(男孩6.4~9.4岁，女孩6.4~8.4岁,Tanner分期均为 I 期)被等比例随机分为3组：5mg孟鲁司特治疗组、倍氯米松吸入治疗组(200 μg, 每日2次)和安慰剂组，治疗期为56周。90%的患儿完成了该研究，研究者通过监测患儿的身高增长速率评估药物对生长的影响。

结果显示，孟鲁司特组和安慰剂组患儿的身高增长速度无显著差异(1年平均差0.03cm)；吸入倍氯米松组患儿身高平均增长速度低于安慰剂组或孟鲁司特组患儿(分别相差0.78cm和0.81cm, P值均<0.001)。吸入倍氯米松治疗的患儿骨转换指标不均衡，而孟鲁司特治疗组则无此异常。

研究提示：青春期前哮喘患儿应用孟鲁司特治疗1年不会影响身高，而倍氯米松吸入治疗可使患儿身高增长速率减慢。

相关化学品信息

[153720-01-5](#) [15382-76-0](#) [15155-38-1](#) [157199-63-8](#) [155178-03-3](#) [158734-25-9](#) [1540-37-0](#) [阿米哌隆](#) [15777-02-3](#) [151793-16-7](#) [15110-84-6](#) [15194-58-8](#) [15334-19-7](#) [15604-06-5](#) [158268-30-5](#) 438