

当前位置: 科技频道首页 >> 新药研发 >> 化学药 >> 巯甲丙脯酸的研究

请输入查询关键词

科技频道

搜索

## 巯甲丙脯酸的研究

关键词: [巯甲丙脯酸](#) [降压药](#) [药物化学](#) [制药工艺](#)

所属年份: 2002

成果类型: 应用技术

所处阶段:

成果体现形式:

知识产权形式:

项目合作方式:

成果完成单位: 上海医药工业研究院

成果摘要:

巯甲丙脯酸是美国Squibb公司1977年开始研究、八十年代开发上市的产品,是一种用于治疗高血压和充血性心力衰竭的新型药物,是血管紧张素转换酶的特异抑制剂(ACE抑制剂),很有发展前途。上海医工院于1978年开始研究。在制得样品后,参考了专利资料,对各种合成路线综合分析对比,选择了各步反应的原料、试剂、溶剂立足于国内的酰氯法,并进行了工艺改革,具有路线短、成本低、收率高的优点。其工艺改进有:1.硫代己酸和甲基丙烯酸的加成中,简化工艺,加成和酰氯二步连乘收率提高到65.85%(文献49.79%)。2.3-乙酰硫基-2-甲基丙酰氯与L-脯氨酸缩合,改用缩合剂,收率达95.73%。3.缩合酸以其乙酸乙酯溶液直接加乙环己胺成盐,以分离光学异构体。简化操作,使成盐分离的收率提高到41.31%(文献33.17%)。4.参考文献改用催化剂,收率提高到67.52%(文献42.42%)。5.回收L-脯氨酸,使成本降低。上述工艺改进后使L-脯氨酸总计收率由文献的10.69%提高到26.74%,为文献的2.5倍,以甲基丙烯酸计总收率由文献的5.5%提高到17.61%,为文献的3.2倍。无需特殊设备。该药研制成功,在ACE类药物的合成与生产方面填补了国内一项空白,临床效果与国外同种药品相同。鉴定意见:1.巯甲丙脯酸在低盐饮食或与利尿剂合并使用时,有较高的降压效应,降压幅度大,作用迅速,适用于治疗中重型高血压,肾实质性与肾血管性高血压以及充血性心力衰竭,它的试制成功为这些疾病提供了新的治疗手段。2.该药在ACE抑制剂类药物合成与生产方面填补了一项国内空白,临床效果与国外同种药品相同。3.巯甲丙脯酸副作用较轻,但在大剂量时少数病人可能出现皮疹或白细胞减少。4.本品工艺和质量标准基本可行,但仍需要积累数据,进一步提高工艺水平,完善质量标准。

成果完成人: 谢美华;陈如霞;李德荣;夏屏南;钱麟兴

[完整信息](#)

### 行业资讯

[甾体活性化合物的研制及合成...](#)

[醋酸祛炎舒松的工艺改进](#)

[基因工程生长激素及生长因子...](#)

[一种单甲氧基聚乙二醇-胰岛素...](#)

[长效复方消炎磺注射液的研制](#)

[磺基甜菜碱中型试验](#)

[化学合成生产硫酸伪麻黄碱](#)

[氨氯地平](#)

[结合态孕马混合雌激素提取方法](#)

[人绒毛膜促性腺激素\(HCG\)的纯...](#)

### 成果交流

### 推荐成果

- [基于内源性物质的寡肽活性物...](#) 04-17
- [中国独创的一类抗癌新药-铭铂](#) 04-17
- [靶向PKC-alpha mRNA的反义药...](#) 04-17
- [维生素E的高效液相色谱分析法](#) 04-17
- [稀有金属锆-有机酸系列化合物...](#) 04-17
- [圈卷产色链霉菌变株](#) 04-17
- [\(S\)-异丝氨酸的合成](#) 04-17
- [抗前列腺增生药物-非那甬胺的...](#) 04-17
- [病毒抑制剂的设计合成及活性测定](#) 04-17

>> 信息发布

[版权声明](#) | [关于我们](#) | [客户服务](#) | [联系我们](#) | [加盟合作](#) | [友情链接](#) | [站内导航](#) | [常见问题](#)  
国家科技成果网

京ICP备07013945号