

当前位置: 科技频道首页 >> 新药研发 >> 化学药 >> 枸橼酸他莫昔芬

请输入查询关键词

科技频道

搜索

枸橼酸他莫昔芬

关键词: **枸橼酸他莫昔芬 雌激素受体 抗雌激素药物 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: 上海华联制药厂百灵分厂

成果摘要:

枸橼酸他莫昔芬是一个抗雌激素药物,属三苯乙烯类化合物,其化学名为1-(对-β-二甲氨基乙氧苯基)-反式-1, 2-二苯丁烯-1(Z型)。1964年英国帝国化学工业公司首先合成,1969年开始应用于临床。本品在体内通过与雌二醇竞争和乳腺癌细胞中的雌激素受体结合,从而抑制乳腺癌细胞的增殖。临床应用于晚期乳腺癌及卵巢癌。由于本品毒性很小,用药期间无明显副作用,因此,已有70多个国家使用本药。上海第十二制药厂在1981年开始试验,所得样品经红外、核磁共振测试验证了结构。同时又不断改进工艺技术,对E、Z两种不同构型体的分离作了改进,以对溴苯酚代替对溴苯甲醚,采用漂白粉精进行三废处理,使合成工艺符合生产要求。本品以苯乙酸为起始原料,经7步化学反应获得成品,平均总收率为8.39%。片剂的释放度与国外样品相仿,也符合美国药典规定。本品在上海肿瘤医院、医科所肿瘤医院、北京首都医院、北京肿瘤防治所、四川医学院附属医院等单位进行了临床验证。共收集可评价病例86例,其中完全缓解14例,部分缓解22例,稳定7例,无效22例,总有效率为54.05%。鉴定意见:1.枸橼酸他莫昔芬对于乳腺癌、卵巢癌有确切的疗效,缓解率为50%~75%左右,而对于雌激素受体阳性病人缓解率更高。在用药期间无明显副作用。对于一些不能耐受其他化疗药物的病人,可先以本品治疗,待病情稳定后再采用其他手段,可以提高疗效。2.上海第十二制药厂采用苯乙酸为起始原料,经七步反应获得本品,原料易得,工艺可行,可以扩大试生产。3.有待进一步解决的问题。(1)希进一步改进工艺,提高收率,降低成本,并对“三废”问题在投产前加以落实。(2)在试生产过程中,暂以融点法控制成品中E型异构体,尽快于短期内以高压液相色谱法代替融点法以严格保证质量。

成果完成人: 郑筠青;韩蓉蓉;周蓓;陈克琳;陈亦玲;季军

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-α 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-非那甾胺的... 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