

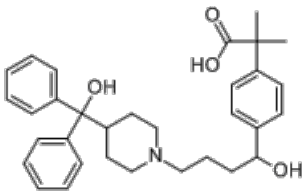


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[83799-24-0](#), 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](#)

CAS Number:83799-24-0 基本信息

中文名:	非索芬那定; 非索非那定; 4-[4-[4-(羟基二苯基甲基)-1-哌啶基]-1-羟基丁基]-alpha,alpha-二甲基苯乙酸
英文名:	Fexofenadine
别名:	4-[1-Hydroxy-4-[4-(hydroxydiphenylmethyl)-1-piperidinyl]butyl]-alpha,alpha-dimethylbenzeneacetic acid
分子结构:	
分子式:	C ₃₂ H ₃₉ NO ₄
分子量:	501.66
CAS登录号:	83799-24-0

CAS#83799-24-0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. 83799-24-0](#) 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:	非索非那定 (83799-24-0) 的用途: 组胺H ₁ 受体拮抗剂。 用于治疗过敏性鼻炎。
	非索非那定 (83799-24-0) 的生产方法: 对溴苯乙酸溶于甲醇, 在三甲基氯化硅作用下, 进行酯化得对溴苯乙酸甲酯。将其溶于四氢呋喃, 然后加到氢氧化钠的四氢呋喃溶液, 再滴加碘甲烷, 加毕在室温和氮气保护下搅拌反应, 甲基化得4-溴-α, α-二甲基苯乙酸甲酯。该甲基化产物和3-丁炔-1-醇溶于三乙胺, 在搅拌下依次加入四(三苯膦)络钨和溴化铜, 在氮气下回流反应, 取代4位的溴, 得4位的炔基化的产物。将其和甲磺酰氯在吡啶存在下, 于二氯甲烷进行甲磺酰化反应。该甲磺酰产物和α, α-二苯基-4-哌啶基甲醇及碳酸钾溶于乙腈, 在氮气下回流, 得N上烷基化反应的产物。将其溶于甲醇, 加入氧化汞的硫酸溶液, 反应引入羰基。再在甲醇中, 用硼氢化钠还原为羟基。最后在氢氧化钾作用下, 水解得芬非那定。 化合物(I) (20.0g, 0.093mol)溶于240ml甲醇, 在搅拌下滴加三甲基氯化硅(26.0ml, 0.205mol), 在室温和氮气保护下搅拌15h。减压浓缩, 得21.4g微黄色油状物的化合物(II), 收率100%, 直接用于下步反应。 化合物(II) (21.3g, 93.0mmol)溶于100ml干燥四氢呋喃, 在搅拌下, 将其加到氢氧化钠(8.37g, 80%悬浮液, 0.279mol)在350ml干燥四氢呋喃的溶液。再滴加碘甲烷(13.9ml, 0.223mol), 加毕在室温和氮气保护下搅拌15h。加入10g Florisil, 过滤。滤液减压浓缩, 剩下的黄色固体用戊烷(3×250ml)提取。提取液减压浓缩, 残液用硅胶层析, 己烷-乙酸乙酯(10: 1至8: 1)洗脱, 得16.9g化合物(III), 收率71%。 化合物(III) (933mg, 3.63mmol)和3-丁炔-1-醇(550μl, 7.27mmol)溶于15ml三乙胺, 在搅拌下依次加入四(三苯膦)络钨(166mg, 0.144mmol)和溴化铜(62mg, 0.43mmol), 在氮气下回流3.5h。冷却, 减压浓缩, 残物用100ml乙醚提

生产方法及其他:	取。提取液用饱和氯化铵水溶液(2×125ml)洗,无水硫酸镁干燥,减压浓缩。残液用硅胶层析,己烷-乙酸乙酯(2:1)洗脱,得866mg化合物(IV),收率97%。 化合物(IV)(520mg,2.11mmol)溶于6.5ml干燥二氯甲烷和1.48ml吡啶,加入甲磺酰氯(326ml,4.22mmol),在氮气气氛中搅拌20h。加入100ml二氯甲烷,依次用1%硫酸、饱和碳酸氢钠水溶液和饱和盐水洗,洗液再用二氯甲烷提取。有机相合并,无水硫酸镁干燥,减压蒸出溶剂,得684mg化合物(V),收率100%。 化合物(V)(625mg,1.93mmol)、化合物(VI)(644mg,2.12mmol)和800mg碳酸钾溶于10ml干燥乙腈,在氮气下回流12h。冷却,过滤,固体用二氯甲烷反复洗涤。滤液减压浓缩,残物用硅胶层析,己烷-乙酸乙酯(2:1)洗脱,得750mg无定形白色固体的化合物(VII),收率75%。 化合物(VII)(583mg,1.18mmol)溶于2ml甲醇,加入氧化汞的硫酸溶液(10ml含75mg氧化汞的溶液和12ml 4%W/V硫酸的混合液),在55℃下加热3h。加入50ml饱和碳酸氢钠溶液,再用二氯甲烷(4×50ml)提取。提取液用饱和盐水洗,无水硫酸钠干燥,减压浓缩。残物用硅胶层析,先用1:2至3:1的乙酸乙酯-己烷,再用15:1的二氯甲烷-甲醇洗脱,得456mg化合物(VIII),收率75%。 化合物(VIII)(350mg,0.681mmol)溶于5ml甲醇,在搅拌下缓慢加入硼氢化钠(38mg,1.0mmol),在室温和氮气下搅拌20ho加入10ml 3%硫酸水溶液,以破坏过量的硼氢化钠。然后加入饱和碳酸氢钠水溶液,用二氯甲烷(3×75ml)提取。提取液用饱和盐水洗,无水硫酸钠干燥,减压浓缩。残物用硅胶层析,以1:5的己烷-丙酮洗脱,得342mg白色固体的化合物(IX),收率95%。 化合物(IX)(256mg,0.496mmol)溶于3.0ml乙醇,在搅拌下缓慢加入3.0ml 1mol/L氢氧化钾水溶液,加热至80℃,并在此温度下搅拌16h,,冷却,小心加入1mol/L盐酸至Ph=7.0。用超声波使固体分散,然后放置过夜。过滤收集固体,用甲醇重结晶,得189mg白色结晶的芬非那定,收率76%,熔点142~143℃。
相关化学品信息	
83783-89-5 5-(吡啶-4-基甲基)-4H-1,2,4-三唑-3-胺 83621-89-0 4-正庚基苯甲酸-4-正丙基苯酯 832740-47-3 834-94-6 83729-01-5 83219-99-2 83-69-2 83724-82-7 4,4'-[(9,10-二氢-9,10-二氧代-1,4-亚蒽基)二亚氨基]二(3-甲苯磺酸)二钾 83511-84-6 83890-10-2 83810-28-0 83079-77-0 489	
生成时间2014-6-16 9:56:06	