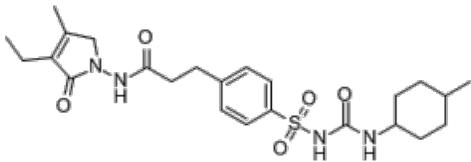




本PDF文件由 爱化学 IChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[93479-97-1](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:93479-97-1 基本信息

中文名:	格列美脲; 1-[4-[2-(3-乙基-4-甲基-2-氧代-3-吡咯啉-1-甲酰胺基)-乙基]-苯磺酰]-3-(反式-4-甲基环己基)-脲
英文名:	Glimepiride
别名:	1-[[p-[2-(3-Ethyl-4-methyl-2-oxo-3-pyrroline-1-carboxamido)ethyl]phenyl]sulfonyl]-3-(trans-4-methylcyclohexyl)urea; Amary
分子结构:	
分子式:	C ₂₄ H ₃₄ N ₄ O ₅ S
分子量:	490.62
CAS登录号:	93479-97-1

物理化学性质

熔点:	212-214°C
性质描述:	格列美脲(93479-97-1)的化学性质: 熔点207°C。

安全信息

安全说明:	S25: 避免接触眼睛。 S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。 S53: 避免暴露——使用前先阅读专门的说明。 S36/37: 穿戴合适的防护服和手套。
危险类别码:	R21: 与皮肤接触有害。 R46: 可能引起遗传基因损害。 R62: 有削弱生殖能力的危险。 R63: 可能危害未出生婴儿。 R36/38: 对眼睛和皮肤有刺激作用。

CAS#93479-97-1化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

大连美仑生物技术有限公司 专业从事93479-97-1及其他化工产品的生产销售 0411-82593631、82593920

百灵威科技有限公司 格列美脲专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 400-666-7788

将来试剂—打造最具性价比试剂品牌 长期供应1-[4-[2-(3-乙基-4-甲基-2-氧代-3-吡咯啉-1-甲酰胺基)-乙基]-苯磺酰]-3-(反式-4-甲基环己基)-脲等化学试剂, 欢迎垂询报价 021-61552785

孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 生产销售C24H34N4O5S等化学产品, 欢迎订购 0712-2580635 15527768836

将来试剂—打造最具性价比试剂品牌 是以Glimepiride为主的化工企业, 实力雄厚 021-61552785

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. 93479-97-1](#) 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: 降血糖药。

格列美脲(93479-97-1)的生产方法:

3-乙基-2, 5-二氢-4-甲基-2-氧-1H-吡咯和异氰酸苯乙酯反应, 再用氯磺酸进行氯磺化, 氨解为磺酰胺, 最后和异氰酸对甲环己基酯缩合, 即得产品。

或者氯磺化的产物先和氨基甲酸甲酯反应后, 再和对甲基环己胺缩合, 也可得产品。

格列美脲(93479-97-1)的药理毒理:

本品为第三代磺酰脲类长效抗糖尿病药, 其作用机制是通过与胰腺β-细胞表面的磺酰脲受体(相对分子质量为 6.5×10^4 的蛋白质)结合, 此受体与ATP敏感的 K^+ (KATP)通道相耦连, 促使KATP通道关闭, 引起细胞膜的去极化, 使电压依赖性钙通道开放, Ca^{2+} 内流而促使胰岛素的释放, 并抑制肝葡萄糖的合成。近期的研究表明, 不同的磺酰脲类药物与KATP的亲合力不同。其顺序为: 优降糖>格列美脲>甲苯磺丁脲>氯磺丙脲。此外, 格列美脲还可以通过非胰岛素依赖的途径增加心脏葡萄糖的摄取, 这可能是葡萄糖转运因子1, 4两种蛋白质表达作用增加所致。由于格列美脲对心血管KATP通道的作用弱于格列波脲、格列齐特及格列吡嗪。故心血管的不良反应亦很少。

格列美脲(93479-97-1)的药代动力学:

12名健康成年男子单次口服1mg格列美脲, 可完全吸收, T_{max} 为(2.7±1.4)h, C_{max} 为(88±21)ng·mL⁻¹。AUC在剂量1~8mg范围呈线性增长。多次服用4或8mg本品未发现蓄积。本品蛋白结合率大于99.5%, 分布容积为8.8L。

本品主要由肝代谢, 主要代谢产物为羟甲基乙羧衍生物。其羟化物由CYP2C9形成, 并具有药理活性。主要从尿排泄, 单次口服1~8mg后, 总清除率(CL/F)为2.7~3.2L·h⁻¹。

格列美脲(93479-97-1)的适应症:

单纯饮食控制和锻炼未能控制血糖的2型糖尿病患者。

格列美脲(93479-97-1)的用法用量:

初始剂量为1mg, qd, 早餐含服最好, 根据血糖监测结果, 每1~2周按1, 2, 3, 4, 6mg递增, 个别患者最大剂量可用至8mg。

用量一般视血糖水平而定, 应使用获得血糖满意控制的最小剂量。根据定期血糖、尿糖监测结果确定初始剂量及维持剂量, 监测血糖、尿糖还有助确定该药是否出现原发或继发失效。

初始剂量及剂量调整: 初始剂量为1mg, 一天一次。若需要, 可以增加每天的剂量。建议根据血糖监测结果, 逐渐增加剂量, 如: 每1~2个星期按以下步骤增加剂量: 1mg~2mg~3mg~4mg~6mg, 仅个别病人需用至8mg。糖尿病得到良好控制的病人, 一般每天剂量为1~4mg, 仅少数病人每天剂量大于6mg。

服药时间: 根据病人的生活方式确定其服药时间。一般一天一次顿服即可, 建议于早餐之前服用, 若不吃早餐, 则于第一次正餐之前服用。尤其注意, 服药后不要忘记进餐。

后续剂量调整: 随着糖尿病症状的改善, 胰岛素敏感性的增加, 本药的需要量也应逐渐减少, 为避免低血糖发生, 应及时减少药量, 甚至停用。本药的治疗一般需长期进行。

从其他口服降糖药改为本药: 本药与其他口服降糖药没有确切的剂量关系。当用本药代替其它口服降糖药时, 建议起始剂量为每天1mg, 即使正在使用最大剂量的其它口服降糖药时也应如此。本药剂量的增加应该遵照上述“初始剂量及剂量调整方法”的要求去做。考虑到以前降糖药的效力及持续作用时间, 需要中断一下治疗, 以避免药物累加作用而引起低血糖。

格列美脲(93479-97-1)的不良反应:

生产方法及其他:

低血糖：由于本药具有降低血糖的作用，可以引起低血糖(有时可致低血糖持续时间延长)。低血糖可能引起的症状有：头疼、极度饥饿感、恶心、呕吐无力、嗜睡、睡眠障碍、烦躁不安、攻击行为、注意力不集中、反应性和警觉性受到损害、抑郁、意识模糊、讲话语无伦次、失语症、视力障碍、震颤、轻瘫、感觉紊乱、头晕、无助感、失去自我控制、谵妄、脑性惊厥、嗜睡及丧失知觉，甚至出现昏迷、呼吸浅及心动过缓。另外，还可出现肾上腺素能反向调节的体征，如：大汗、皮肤潮湿、焦虑、心动过速、高血压、心悸、心绞痛和心律不齐，严重的低血糖症状可表现为中风发作。当低血糖控制以后，上述低血糖症状几乎全部消失。

眼：尤其是在治疗开始阶段，由于血糖的改变，可能对视力产生暂时性影响。

消化系统：偶见胃肠道症状：恶心、呕吐、压迫感或上腹部胀满感、腹痛、腹泻。极个别病例可出现肝酶升高、肝功能损害(如胆汁郁积和黄疸)及肝炎，可能导致肝功衰竭。

血液：可能出现严重的血象改变：罕见有血小板减少症、极个别病例可发展为白细胞减少、溶血性贫血或红细胞减少，粒细胞缺乏症和全血细胞减少(由于骨髓抑制引起的)。

其他不良反应：偶见有过敏或假性过敏反应，如瘙痒、荨麻疹或皮疹，这些轻微的反应严重时可导致呼吸困难、血压降低，有时发展为休克。极个别病例可出现下列症状：过敏性脉管炎、皮肤光过敏和血钠降低。一些严重的不良反应如严重的低血糖、血象的某些改变、严重的过敏或假性过敏反应、肝功衰竭，在某些情况下，可能危及生命。

格列美脲(93479-97-1)的注意事项：

对本品过敏者。1型糖尿病患者，糖尿病酮症酸中毒及高渗综合征患者，严重肝肾功能损害和透析患者，妊娠和哺乳期妇女禁用。治疗最初几周内，出现低血糖的危险性可能增大，需仔细观察，定期监测血糖及尿糖。妊娠期病人应换成使用胰岛素。对计划怀孕的病人，建议换用胰岛素治疗。

若发生服药差错，如漏服一次药量，不可于下次服药时以大剂量来纠正。当病人的体重或病人的生活方式发生改变或出现其它情况，导致病人易出现低血糖或高血糖时应考虑调整剂量。

为了达到治疗目的—最佳的血糖控制，坚持正确饮食、规律而有效的体育锻炼、必要时，实施减肥，与规律服用本药治疗同样重要。

血糖未能有效控制(高血糖)的临床征象是：尿频加剧、口渴加重、口干和皮肤干燥。在治疗的最初几周内，出现低血糖的危险性可能增加，需要给予特别观察。

导致低血糖的因素包括：不愿或者无能力合作(多见于老年患者)；营养不良，饮食无规律或未及时进餐；体力消耗和碳水化合物摄入的不平衡；饮食改变；饮用酒精，特别是在未及时进餐的情况下；肾功能损害；肝功严重受损；过量服用；某些影响碳水化合物代谢的内分泌系统出现失代偿性的紊乱或低血糖的反向调节(例如一些甲状腺功能紊乱和垂体前叶或肾上腺皮质功能不全)；与其它某些药物合用。如果病人有这些导致低血糖的危险因素存在，就应调整本药的剂量或整个治疗方案，病人在治疗中患了其它疾病或者改变了生活方式时，也应调整治疗。这些反映机体肾上腺素能反向调节作用的低血糖症状在以下情况时会减弱或缺乏，如：低血糖缓慢发生时(尤其老年病人)，以及有自主神经病变或同时服用β-阻滞剂、氯压定、利血平、胍乙啶或其他抗交感神经药物的病人。

治疗低血糖的方法是立即摄入碳水化合物而获迅速控制(葡萄糖或蔗糖，如糖块、含糖的果汁或加糖的茶)，为此，病人应该随身携带至少20克葡萄糖。人工甜味剂对治疗低血糖无效。从其他的磺脲类药物获知，尽管开始能成功地控制低血糖，但低血糖仍会再次出现，所以仍需对病人密切观察。严重的低血糖需要紧急治疗及医生的随访，某些情况下，病人需要住院治疗。在一些特殊的紧急情况下(如创伤、手术、发热感染)，血糖的控制恶化，此时，需要临时改用胰岛素治疗。

应用本药治疗期间，必须定期监测血糖及尿糖。另外，建议定期检查糖化血红蛋白。由于低血糖或高血糖的发生，可能导致警觉性和反应性下降，特别是在更改治疗方法的前后或没有按时服用亚莫利的时候，很可能会影响驾车

或操纵机器。

对妊娠和哺乳的影响 妊娠期不能服用本药，应换成使用胰岛素。为了防止本药可能自乳汁吸收伤害婴儿，哺乳妇女不要服用本药，需改为胰岛素治疗或停止哺乳。

格列美脲(93479-97-1)的药物相互作用：

本品与其他高蛋白结合率的药物同服时，由于与血清蛋白竞争性结合而使本品的AUC和C_{max}分别降低34%和4%，但不改变血浆中葡萄糖和C肽的浓度。[普萘洛尔](#)可使本品的C_{max}，AUC和T_{1/2}分别显著增加23%，22%和15%，并使CL/F减少18%。与ACE抑制剂同服时，可能增强本品的降糖效果。

当与下列具有增强降血糖作用的某个药物合用时，可能会导致低血糖发生，例如：胰岛素、其他降糖药、ACE抑制剂、[别嘌醇](#)、具合成代谢的类固醇及男性性激素、氯霉素、香豆素衍生物、[环磷酰胺](#)、双异丙吡胺、氟苯**丙胺**、苯吡胺醇、纤维素衍生物、氟苯氧丙胺、胍乙啶、异环**磷酰胺**、MAO抑制剂、环氯苯咪唑、对氨**水杨酸**、己酮可可碱(胃肠外高剂量)、保泰松、炎爽痛、羟基保泰松、丙磺舒、喹诺酮类、水杨酸、苯磺唑酮、磺胺类、四环素族、三乙氧喹、氯乙环磷酰胺。

当与下列具有减弱降血糖作用的某个药物合用时，可能会引起高血糖，例如：乙酰唑胺、巴比妥类、皮质类固醇、[氯甲苯噻嗪](#)、利尿药、肾上腺素和其他拟交感神经药物、高血糖素、轻泻药(长期使用)、[烟酸](#)(高剂量)、雌激素和孕激素，[吩噻嗪](#)、苯妥英、利福平、甲状腺激素。H₂受体拮抗剂、氯压定和利血平可能会增强或减弱降血糖作用。b-阻滞剂可降低糖耐量，可导致糖尿病病人代谢控制恶化。另外，b-阻滞剂还可使病人容易出现低血糖(由于使反向调节作用受损)。在抗交感神经药物如b-阻滞剂、氯压定、胍乙啶和利血平的作用下，对低血糖的肾上腺素反向调节作用可能会减弱或缺乏。无法预料急性和慢性饮酒对亚莫利的降血糖作用是增强还是减弱。香豆素衍生物的作用可能是增强或减弱。

相关化学品信息

[93840-58-5](#) [苯磺酸钙](#) [93106-68-4](#) [93003-68-0](#) [93904-89-3](#) [936250-03-2](#) [93918-87-7](#) [93805-40-4](#) [93839-88-4](#) [3-甲氧基-4-三氟甲基吡啶](#) [93851-06-0](#) [93841-22-6](#) [93194-15-1](#) [93765-83-4](#) [93980-72-4](#) 434

生成时间2016-6-27 14:10:03