

盐酸鲁拉西酮 成人精神分裂原料药API生产研发

产品名称	盐酸鲁拉西酮 成人精神分裂原料药API生产研发
公司名称	南京辰瑞晟生物医药科技有限公司
价格	.00/件
规格参数	品牌:CRS 型号:CMO 产地:国产
公司地址	南京市雨花台区安德门大街57号楚翘城5幢503-008室（注册地址）
联系电话	0571-87428035 15360676961

产品详情

中文名称:盐酸鲁拉西酮

中文同义词:盐酸鲁拉西酮(罗西酮盐酸盐);盐酸卢拉西酮LURASIDONHYDROCHLORIDE;盐酸卢拉西酮;罗西酮盐酸盐;盐酸鲁拉西酮;外二烯卢拉西酮;罗拉西酮盐酸盐;盐酸鲁拉西酮-罗拉西酮盐酸盐英文名称:Lurasidonehydrochloride

英文同义词:Lurasidonehydrochloride;Lurasidonehydrochlorid;(3aR,4S,7R,7aS)-2-[[[(1R,2R)-2-[[4-(1,2-Benzisothiazol-3-yl)-1-piperazinyl]methyl]cyclohexyl]methyl]hexahydro-4,7-methano-1H-isoindole-1,3(2H)-dionehydrochloride;(3aR,4S,7R,7aS)-2-(((1R,2R)-2-((4-(benzo[d]isothiazol-3-yl)piperazin-1-yl)methyl)cyclohexyl)methyl)hexahydro-1H-4,7-methanoisoindole-1,3(2H)-dionehydrochloride;LurasidoneHydrochlorideTablets;ExodieneLurasidone;LurasidoneHCl/LurasidoneHydrochloride;(3aR,4R,7S,7aS)-2-(((1R,2R)-2-((4-(benzo[d]isothiazol-3-yl)

CAS号:367514-88-3

分子式:C₂₈H₃₆N₄O₂S

分子量:492.684

EINECS号:682-423-6

简介lurasidone（鲁拉西酮）是一种非典型抗精神病药物，由住友制药发现和开发。与其他现有的抗精神分裂症药物相比，鲁拉西酮具有独特的化学结构，据信对多巴胺D₂、5-羟色胺（5-HT_{2A}）、5-羟色胺（5-HT₇）受体均具有亲和力，在这些受体中具有拮抗作用。此外，鲁拉西酮对5-羟色胺（5-HT_{1A}）受体具有部分激动作用，对组胺H₁或毒蕈碱M₁受体无明显的亲和力。作用机制与在精神分裂症中有效的其它药物一样，卢拉西酮的作用机制是未知的。已经表明，通过2型中枢多巴胺（D₂）和2型5HT_{2A}受体（5HT_{2A}）受体拮抗作用的组合介导精神分裂症中卢拉西酮的功效。应用盐酸鲁拉西酮是有机合成中间体

和医药中间体，可用于实验室研发中有机合成过程和化工医药合成过程中。适应症LATUDA是一种非典型的抗精神病药，用于治疗精神分裂症患者。在成年精神分裂症患者的四个6周对照研究中建立功效。生物活性Lurasidone(SM-13496)是一种非典型的抗精神病药物，抑制D2，5-HT_{2A}，5-HT₇，5-HT_{1A}和去甲肾上腺素 2C，IC₅₀分别为1.68nM，2.03nM，0.495nM，6.75nM和10.8nM。

体外研究Lurasidone剂量依赖性拮抗多巴胺刺激的人多巴胺D_{2L}受体上[³⁵S]GTP S结合，KB值为2.8nM。Lurasidone拮抗CHO/h5-HT₇细胞中5-HT刺激的cAMP积累，KB值为2.6nM。Lurasidone部分刺激[³⁵S]GTP S结合到人5-HT_{1A}受体的膜制剂上，*大作用为33%。Lurasidone剂量依赖性增加大鼠额叶皮层和纹状体中DOPAC/多巴胺比率。体内研究Lurasidone抑制MAP诱导的功能亢进，该作用能够持续8小时以上，以2.3mg/kg，0.87mg/kg，1.6mg/kg，和5.0mg/kg的剂量治疗时，ED₅₀值分别为1小时，2小时，4小时和8小时。Lurasidone(1mg/kg – 10mg/kg)剂量依赖性抑制大鼠条件性回避反应，ED₅₀为6.3mg/kg。Lurasidone剂量依赖性抑制大鼠体内TRY诱导的前爪阵挛发作和p-CAMP诱导的体温过高，ED₅₀分别为5.6mg/kg和3.0mg/kg。Vogel冲突试验中，Lurasidone(0.3mg/kg – 30mg/kg)剂量依赖性显著增加大鼠受到惊吓的次数，MED为10mg/kg。Lurasidone(3mg/kg,2周)显著抑制嗅球切除大鼠的多动症。Lurasidone(700mg/kg – 1000mg/kg)剂量依赖性略微延长小鼠体内环己烯巴比妥(麻醉)诱发的翻正反射损失的持续时间。Lurasidone(30mg/kg,p.o.)显著剂量依赖性逆转大鼠体内MK-801诱导的被动反应回避的衰减。Lurasidone(3mg/kgp.o.)有效逆转MK-801诱导的大鼠在水迷宫测试中的学习障碍。在径向臂迷宫测试中，Lurasidone(3mg/kgp.o.)有效逆转MK-801诱导的参考记忆受损，并且适度而不显著地减弱MK-801诱导的工作记忆受损。Lurasidone(10mg/kg)治疗增加大鼠前额皮质和海马体(较小程度)中总BDNFmRNA水平。Lurasidone(10mg/kg)显著增加大鼠前额皮质中成熟BDNF蛋白质的水平，而不影响海马体提取物中神经营养因子(前体和成熟形式)的蛋白水平。