

达格列净Dapagliflozin达格列净 API 柯莱生物原料CAS号461432-26-8

产品名称	达格列净Dapagliflozin达格列净 API 柯莱生物原料CAS号461432-26-8
公司名称	杭州柯莱生物医药科技有限公司
价格	.00/件
规格参数	CAS号:461432-26-8 分子式:C ₂₁ H ₂₅ ClO ₆ 英文名:Dapagliflozin
公司地址	浙江省杭州市上城区海运国际大厦1号楼1903室-12（自主申报）（注册地址）
联系电话	17357819709

产品详情

中文名称达格列净中文同义词达格列净50G;达格列净(游离碱);达格列净/(1S)-1,5-脱水-1-C-[4-氯-3-[(4-乙氧基苯基)甲基]苯基]-D-葡萄糖醇;达格列净(无水);达帕格列佛净杂质;达格列净/达格列净;达格列净异构体杂质;达格列净API英文名称Dapagliflozin英文同义词DAPAGLIFLOZIN;(1S)-1,5-Anhydro-1-C-[Chemicalbook4-chloro-3-[(4-ethoxyphenyl)methyl]phenyl]-D-glucitol;Dapagliflozinpropanediol;BMS-512148-05;DapagliflozinS1548Selleck;DAPAGLIFLOZINBASE;Daglican;DapaglifloziCAS号461432-26-8分子式C₂₁H₂₅ClO₆

糖尿病药物达格列净(dapagliflozin, Forxiga™)是由百时美施贵宝和阿斯利康公司联合开发的一种新型的抗糖尿病药物,于2012年11月12日被欧洲药品管理局(EMA)批准上市,是第1个获准上市用于治疗2型糖尿病的SGLT2抑制剂,可作为糖尿病药物治疗中的重要选择,适用在有2型糖尿病成人中作为辅助饮食和运动改善血糖控制。达格列净是一种钠-葡萄糖协同转运蛋白2抑制剂,美国食品药品监督管理局(FDA)于2014年1月8日宣布,批准将达格列净用于2型糖尿病的治疗,Chemicalbook同时要求生产商就药物相关风险开展上市后研究。FDA要求的上市后试验包括一项评估基线时心血管疾病高危患者使用达格列净治疗后的心血管风险的心血管结局试验和一项评估招募患者的膀胱癌风险的研究。另有一项研究将评估该药物对啮齿类动物的膀胱肿瘤促进效应。两项研究将在儿科患者中评估达格列净的药代动力学、疗效和安全性;一项加强的药物警戒计划将在接受达格列净治疗的患者中监测肝脏异常和妊娠结局报告。达格列净将由HaoeyouPharmacy(好医友美国药房)销售,商品名为Farxiga。

药理作用达格列净通过抑制钠-葡萄糖转运蛋白2(SGLT2)——肾内的一种使葡萄糖被重新吸收到血液中的蛋白质——而发挥作用。这使得多余的葡萄糖通过尿液被排除体外,从而在不增加胰岛素分泌的情况下改善血糖控制。使用这种药物要求患者的肾功能正常,中至重度肾功能不全患者禁用该药。本品单用或与二甲双胍、吡格列酮、格列齐特、格列美脲、胰岛素等药物联合使用,可以显著降低2型糖尿病

患者的HbA1c和空腹血糖，不良反应发生率与安慰剂相似，低血糖风险低，可减轻体重。达格列净的疗效与二肽基肽酶抑制剂等数种新型降糖药物相当，而且可轻度降低血压和体重。该药有5mg和10mg两种片剂可供选择，可单独使用或与包括胰岛素在内的其他糖尿病药物联用。

药动学在健康受试者中，达格列净口服后快速吸收，达峰时间T_{max}为1~2h，蛋白结合率为91%，口服生物利用度约为78%，血浆终末半衰期为12.9h。口服后，药物主要在肝脏经尿苷二磷酸葡萄糖苷酸基转移酶1A9(UGT1A9)代谢为无活性的代谢物，较小部分经P450酶代谢，对P450酶没有抑制或诱导作用。药物原型和相关代谢物75%经尿排泄，21%经粪便排泄。本品与高脂食物同时服用与空腹服用相比，T_{max}延长1倍，但是吸收程度没有影响，因此可与食物同服。肾功能对达格列净的药动学有较大影响，合并轻度、中度或重度肾功能不全的糖尿病患者口服达格列净20mg·d⁻¹共7d，该药的平均系统暴露较肾功能正常的糖尿病患者分别高32%，60%和87%。在肾功能正常、轻度不全、中度不全和重度不全的糖尿病患者中，药物达稳态时24h的尿糖排泄量依次为85，52，18，11g。Kasichayanula等研究了肝功能不全对达格列净的药动学影响。轻、中度和严重肝功能不全的受试者单次口服达格列净10mg，各组C_{max}分别较肝功能正常者低12%、高12%和高40%，各组AUC分别较肝功能正常者的高3%，36%和67%。因此，中度和重度肾功能不全者不推荐使用达格列净，重度肝功能不全患者需要减少使用剂量。