

本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[151319-34-5](#), 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](#)

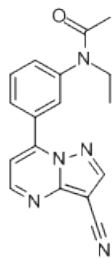
CAS Number:151319-34-5 基本信息

中文名: 扎雷普隆;
扎莱普隆;
N-乙基-N-3-[7-(3-氰基吡唑并[1,5a]嘧啶基)苯基]乙酰胺

英文名: Zaleplon

别名: N-[3-(3-cyanopyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-yl)phenyl]-N-ethylacetamide

分子结构:

分子式: $C_{17}H_{15}N_5O$

分子量: 305.33

CAS登录号: 151319-34-5

物理化学性质

性质描述: 白色或类白色晶体粉末

安全信息

安全说明: S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。
S36: 穿戴合适的防护服。

危险类别码: R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#151319-34-5化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

随州天丰化工科技有限公司 专业从事**151319-34-5**及其他化工产品的生产销售 027-88325527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. 151319-34-5](#) 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: 催眠镇静原料药

1. 扎来普隆(151319-34-5)的规格:

含量应大于或等于99%; 干燥失重应小于1.0%; 炽烧残渣应小于0.2%; 重金属含量应小于0.002%。

2. 扎来普隆(151319-34-5)的生产方法:

①以间氨基**苯乙酮**为原料。间氨基**苯乙酮**和**碳酸钾**溶于**二氯甲烷**, 滴加醋酐, 回流反应; 冷却, 控制在40℃滴加二甲基甲酰胺-二甲缩醛, 滴毕回流反应; 回收溶剂, 加入**水**, 过滤; 滤饼水洗, 干燥得N-[3-(3-二甲基氨基-1-氧代-2-丙烯基)苯基]乙酰胺。

②将其溶于二甲基甲酰胺, 冷却下分批加入氢化钠, 40℃反应后, 再滴加溴乙烷, 滴毕继续反应; 倾入冰水, 搅拌, 放置过夜, 过滤, 水洗, 干燥, **甲醇**重结晶, 得3-二甲基氨基-1-[(3-N-乙基-N-乙酰胺基)苯基]-2-丙烯-1-酮。

	③将该产物、3-氨基-4-氰基吡唑和冰醋酸混合，在80℃共热，冷却，过滤，滤饼用醋酸-水(1:3)洗，干燥，乙酸乙酯重结晶，得扎来普隆(151319-34-5)。 3. 药理毒理： 该药作为催眠药，其化学结构不同于苯二氮类、巴比妥类及其它已知的催眠药，可能通过作用于γ氨基丁酸-苯二氮(GABA-BZ)受体复合物而发挥其药理作用。非临床研究显示该药可选择性结合脑GABAA受体复合物α亚单位的ω1受体。该药与纯化GABAA受体(α)1β1γ2[ω-1]和(α)2β1γ2[ω-1]结合实验结果显示其与上述受体亲和力较低，可优先结合于ω-1受体。 毒理研究生殖毒性：生殖毒性试验中，大鼠在交配前经口给予该药100mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的49倍)，可导致动物死亡和生育力下降。后续研究显示该药主要引起雌性动物生育力受损。妊娠大鼠和家兔致畸敏感期分别经口给予该药达100和50mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的49倍和48倍)，未见明显致畸作用。但大鼠经口给予该药100mg/kg/天后，胎仔在出生前、后均出现发育不良；此剂量也可产生母体毒性，使其在给药期间出现中毒体征和体重增加减慢。对大鼠仔代发育无影响剂量为10mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的5倍)。在所有给药剂量下家兔胚胎和胎仔的发育未受到影响。 围产期试验中，雌性大鼠在妊娠后期和哺乳期给予该药7mg/kg/天，仔代动物死产和出生后死亡率升高，生长和身体发育减慢。此剂量下未见动物出现母体毒性。对仔代发育的无影响剂量为1mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的0.5倍)。研究显示，子宫内和受乳期仔代动物暴露于药物可能导致其出现生存能力和发育方面的不良反应。 遗传毒性：体外中国仓鼠卵巢细胞染色体畸变试验显示，无论是否存在代谢活化剂，该药均有诱裂变作用，可引起染色体结构和数目的畸变(多倍体和核内再复制)。体外人淋巴细胞试验中，仅在其最高试验浓度和有代谢活化剂的条件下引起染色体数目畸变。 该药在体外Ames细菌试验和中国仓鼠卵巢HGPRT基因突变试验中均未见致突变性，在小鼠骨髓微核试验和大鼠骨髓染色体畸变试验中无诱裂作用，在大鼠肝细胞期外DNA合成试验中未引起DNA损伤。致癌性：进行了大鼠和小鼠终生致癌试验。小鼠连续2年经口给予该药25、50、100和200mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的6-49倍)，高剂量组雌鼠的肝细胞腺瘤发生度显著升高。大鼠连续2年经口给予该药1、10、20mg/kg/天(按体表面积折算，约为推荐人用最大剂量的0.5-10倍)，未见明显致癌性。 4. 药代动力学： 据国外文献报导，在500多名健康人(包括年轻的年老的)、哺乳妇女和有肝病或肾病的病人，进行了该药的药代动力学研究。在健康受试者中，进行了单剂量给药60mg和一天一次给药15mg、30mg共10天的药代动力学研究，该药很快地被吸收，达峰浓度大约1小时，清除半衰期(t1/2)大约为1小时，一天一次给药该药没有药物积累，而且在治疗范围内，它的药代动力学是与剂量成比例的。 吸收该药在口服后，吸收迅速且完全，1小时左右达到血浆峰浓度。其绝对生物利用度大约为30%，有明显的首过效应。 分布该药是一个脂溶性的化合物，静脉给药后，分布容积大约是1.4L/kg，分布在血管外组织。体外血浆蛋白结合率大约是60%±15%，并且不受该药10-1000ng/ml浓度范围的限制，这表明该药对蛋白结合率的变化是不敏感的，该药在血液和血浆中的比率大约是1，这表示该药是均匀地分布在整个血流而没有广泛地分布在红细胞里。 代谢在口服给药后，该药被广泛地代谢，在尿中，仅有不超过剂量的1%是原药。该药主要被醛氧化酶代谢为5-氧-扎来普隆，该药很少被CYP3A4代谢为脱乙基扎来普隆，并很快被醛氧化酶转化为5-氧脱乙基扎来普隆。这些代谢产物然后被转化成葡萄糖醛酸化合物，并在尿中消除，所有的该药的代谢产物均无药理活性。 清除在口服或静脉给药后，该药很快被清除，平均t1/2大约是1小时，该药口服血浆清除率大约为3L/h/kg，静脉血浆清除率大约为1L/h/kg，如肝血流正常和忽略肾清除，估计该药的肝脏提取0.7，表明该药的首过效应是非常明显的。在服用有放射标记的该药后，在48小时内，可在尿中回收70%(6天内可回收71%)，包括所有的该药代谢物和它们的葡萄糖醛酸，另外在粪便中可回收17%，主要是5-氧-扎来普隆。 食物作用在健康成年人中，高脂肪和难消化的食物，可延长该药的吸收，延迟时间大约为2小时，并且Cmax减少大约35%，扎来普隆AUC和消除半衰期没有明显的影响，这表明，在用完高脂肪和难消化的食物后，立即服用该药，其起效时间会有影响。对老年人进行该药药代动力学的三项研究结果显示，该药的药代动力学和年青人没有明显的不同。性别：在男性和女性中，该药的药代动力学没有明显的不同。人种：以日本人作为亚洲人的代表作了该药的药代动力学研究，对这个组，Cmax和AUC分别增强37%和64%，这可能和体重不同有关，也可能由于饮食、环境或别的因素而引起酶活性的不同。肝脏损伤：该药首先是被肝脏代谢，其接着进行全身代谢，其口服清除率在代偿和代偿机能失调的病人减少70%和87%，和健康人相比，导致平均Cmax和AUC明显增加，因此中、轻度肝脏损伤病人服用该药时，应适当减少剂量，患有严重的肝脏损伤病人不建议服用该药。肾脏损伤：因为肾脏排泄的该药的原药
--	---

生产方法及其他:	不到1%，在肾功能不全的病人中，其药代动力学没有明显变化，因此对中、轻度肾脏损伤病人没有必要调整剂量，但对严重的肾脏损伤病人还需进一步研究。 5. 适应症： 适用于入睡困难的失眠症的短期治疗，临床研究结果显示该药能缩短入睡时间，但还未表明能增加睡眠时间和减少唤醒次数。 6. 用法和用量： 成人口服一次5mg-10mg (1-2片)，睡前服用或入睡困难时服用。体重较轻的病人，推荐剂量为一次5mg (1片)。老年病人、糖尿病人和轻、中度肝功能不全的病人，推荐剂量为一次5mg (1片)。每晚只服用一次。持续用药时间限制在7-10天。如果服用7-10后失眠仍未减轻，医生应对患者失眠的病因重新进行评估。 7. 不良反应： 服用该药后，可能会出现较轻的头痛、嗜睡、眩晕、口干、出汗及厌食、腹痛，恶心呕吐、乏力、记忆困难、多梦、情绪低落、震颤、站立不稳、复视其他视力问题，精神错乱等不良反应。 其他不良反应包括： ①服用该药 (10或20mg)，1小时左右会出现短期的记忆缺失，20mg剂量时缺失作用更强，但2小时后就没有这种作用； ②服用该药 (10或20mg) 后，1小时左右有预期的镇静和精神障碍作用，但2小时后就没有这种作用； ③反弹性失眠是剂量依赖性的，临床试验表明，5mg和10mg组在停药后的第一个晚上没有或很少有反弹性失眠，20mg组有一些，但在第二天晚上即消失； ④偶见一过性白细胞升高⑤偶见一过性转氨酶升高。 8. 禁忌： (1) 对本品过敏者禁用。 (2) 严重肝、肾功能不全者禁用。 (3) 睡眠呼吸暂停综合症患者禁用。 (4) 重症肌无力患者禁用。 (5) 严重的呼吸困难或胸部疾病者禁用。 9. 注意事项： (1) 本品为国家特殊管理的第二类精神药品，必须严格遵守国家对精神药品的管理条例，严格在医生指导下使用。 (2) 不要超过医生指定的使用期限，长期服用可能会产生依赖性。有药物滥用史的患者慎用。 (3) 在服用该药后，如发现行为和精神异常，请和医生联系。 (4) 告诉医生你可能服用的所有药物包括非处方药，如果饮酒的话，也应告诉医生。当服用该药或其他安眠药期间，禁止饮酒。 (5) 除非能保证4个小时以上的睡眠时间，否则不要服用本品。 (6) 没有医生的指导，不要随意增加该药的用量。 (7) 第一次服用该药或别的安眠药时，应该知道这些药物在第二天仍然会有一些作用，当需要头脑清醒时，比如驾驶汽车、开机器等慎用。 (8) 停止服药后的第一或两个晚上，可能入睡困难。 (9) 如果你已怀孕或即将怀孕或正在哺乳，请告诉医生。 (10) 不要和别人分享该药，药物应放在儿童拿不到的地方。 (11) 如果你有抑郁症的话，请告诉医生，医生应尽可能少的给予抑郁症患者药物的数量，以防止过量的发生。 (12) 该药起效快，应在上床前立即服用，或上床后难以入睡时服用。 (13) 为了该药更好的发挥作用，请不要在用完高脂肪的饮食后立即服用本品。 (14) 因为该药的不良反应是与剂量相关的，因此应尽可能用最低剂量，特别是老年人。 (15) 与作用脑部的药物联合使用时，可能因协同作用而加重后遗作用，导致清晨仍思睡。这些药物包括：用于治疗精神性疾病的药物 (如精神抑制药、催眠药、抗焦虑药、镇静药、抗抑郁药)。麻醉剂和用于治疗变态反应的药物 (如镇静抗组胺药)。 10. 孕妇及哺乳期妇女用药： 怀孕期间服用本品的安全性未得到数据证实，而且本品代谢入乳汁中，因此哺乳期母亲及将要或已经怀孕妇女禁用本品。
----------	--

11. 儿童用药：
没数据证实儿童服用本品的安全性，所以儿童(小于18岁者)禁用本品。

12. 老年患者用药：
本品可用于老年人，包括大于75岁老人。在老年人及老年妇女包括大于75岁的与健康青年志愿者比较，本品的药代动力学没有明显的不同。由于老年病人对安眠剂影响敏感些，推荐剂量为5mg。

13. 药物相互作用：
与中枢神经系统药物：[乙醇](#)：本品可增强[乙醇](#)对中枢神经系统的损伤作用，但不影响乙醇的药代动力学。丙咪嗪：本品与丙咪嗪合用后，清醒程度降低，运动精神行为能力损伤，相互作用是药效学而没有药代动力学的变化。帕罗西汀：本品与帕罗西汀合用无相互作用。[硫利达嗪](#)：本品与硫利达嗪合用后，清醒程度降低，运动精神行为能力损伤，相互作用是药效学而没有药代动力学的变化。与酶诱导/抑制药物：与酶诱导剂如利福平合用，会使本品的Cmax和AUC降低4倍。本品与[苯海拉明](#)合用无药代动力学相互影响，但由于两者都有镇静作用，合用需特别注意。与影响肾消除药物合用：与布洛芬合用无明显药代动力学变化。

14. 药物过量：
该药用过量的临床研究较少，在临床前研究中注意到，过量用药有中枢神经系统抑制作用而表现，轻微的症状有：瞌睡、昏睡及意识模糊等。严重的症状有：共济失调、肌张力减退、低血压、有时昏迷直至死亡。
建议的治疗：按照药物过量处理的一般原则进行治疗，并保证支持和对症治疗。动物研究表明氟马西尼可拮抗该药，但还没有用于临床。

15. 贮藏：
密封，置避光、阴凉干燥处保存。

16. 有效期：
暂定18个月。

相关化学品信息

[15912-80-8 苺基三苯基碘化磷](#) [爱维莫潘](#) [2,9,16,23-四苯氧基-29H,31H-酞菁氯化铝](#) [4-甲氧基苯酚](#) [4-溴-2-甲基异氰酸苯酯](#) [美替诺龙](#) [3,5-二氟-2-硝基苯酚](#) [N-\[7-\(N,N-二甲胺基\)-4-苯并咪唑基\]二甲氨基乙酰基氯化铵](#) [结晶紫内酯](#) [Lobradimil](#) [3-氨基苯甲酸盐酸盐](#) [5-羟基-4\(1H\)-嘧啶酮](#) [1-\(4-乙氧基苯基\)-1,2-二氢-5H-四唑-5-硫酮](#) [4-氯-3-甲基酚钠盐](#) [氟化钴](#) [麝香草酚](#) [硝酸铈](#)