



本PDF文件由

爱化学
iChemistry.cn免费提供，全部信息请点击[36505-84-7](#)，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:36505-84-7 基本信息

中文名:	丁螺环酮; 8-[4-(嘧啶-2-基)-1-哌嗪基丁基]-8-氮杂螺[4,5]癸烷-7,9-二酮
英文名:	Buspirone
别名:	8-[4-[4-(2-Pyrimidinyl)-1-piperazinyl]butyl]-8-azaspiro[4,5]decane-7,9-dione; Buspar
分子结构:	
分子式:	C ₂₁ H ₃₁ N ₅ O ₂
分子量:	385.50
CAS登录号:	36505-84-7
EINECS登录号:	253-072-2

安全信息

安全说明:	S45: 出现意外或者感到不适，立刻到医生那里寻求帮助（最好带去产品容器标签）。
危险类别码:	R25: 吞咽有毒。

CAS#36505-84-7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. 36505-84-7 查看](#)若您是此化学品供应商，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:	<p>丁螺环酮(36505-84-7)的用途:</p> <p>该药是新一代非苯并二氮杂草类选择性抗焦虑药，通过影响5-HT(5-羟色胺)系统发挥抗焦虑作用，是5-HTIA受体的部分激动剂。</p> <p>它的抗焦虑作用强度与地西泮相当，但没有地西泮类药物的抗惊厥、肌松、精神运动功能减弱等副作用。因而被称为选择性抗焦虑药。久用也不产生自身依赖和欣快效应，成瘾性的倾向较小，不易引起滥用。</p> <p>用于治疗急、慢性焦虑状态，如焦虑性激动、内心不安定和紧张状态等，尚能缓解伴有或不伴抑郁症的焦虑症状。</p>
生产方法及其他:	<p>1. 丁螺环酮(36505-84-7)的生产方法:</p> <p>①2-氨基嘧啶、浓盐酸和二氯甲烷混合，搅拌下加入氯化锌，冷却至5~10°C，分批加入亚硝酸钠，加毕继续反应。倾入冰水，静置，分出有机相。水相用二氯甲烷萃取3次，和有机相合并，干燥，蒸去大部分溶剂后析出浅黄色晶体，熔点63~65°C，即为2-氯嘧啶。</p> <p>②无水哌嗪、碳酸钠和水混合，在50~65°C和搅拌下分批加入2-氯嘧啶，加毕继续反应，慢慢冷至35°C。过滤除去1,4-二(2-氯嘧啶基)哌嗪，滤液用氯仿萃取3次。萃取液干燥，蒸去溶剂，减压蒸馏，收集115~117°C/133Pa(或118~120°C/270Pa)的馏分，即为1(2-氯嘧啶基)哌嗪。</p>

③环戊酮、氨基乙酸甲酯、氨基乙酰胺和甲酰胺混合,室温搅拌下慢慢加入三乙胺,反应。升温至60~65℃,慢慢加入水,再加入98%的硫酸至pH值为1,冷却至5~10℃,过滤,水洗。得到的固体和硫酸一起于130℃加热,再加入水,于150℃回流,冷却,过滤,水洗,粗品用水和异丙醇重结晶,得白色针状结晶,熔点179~181℃,为β,β-四亚甲基戊二酸。

④戊二酸衍生物和醋酐加热回流,过滤,浓缩至干,冰箱中放置过夜,析出白色片晶,过滤,干燥,得戊二酸酐衍生物,熔点64~66℃。戊二酸酐衍生物和浓氨水加热至溶解,迅速倒入瓷盘中,冷却,析出的鳞片状晶体即为戊二酰亚胺衍生物,熔点153~154℃。该亚胺和1,4-二溴丁烷及无水碳酸钾在甲苯中回流,过滤,收集160~170℃/13Pa的馏分,为溴丁基化的亚胺化合物。

⑤最后和1-(2-嘧啶基)哌嗪、无水碳酸钾、正丁醇一起回流,过滤,蒸去溶剂,得到的黄色固体用异丙醇重结晶,得该药物,再和等摩尔的5mol/L氯化氢的乙醇溶液成盐,无水乙醇重结晶,即得盐酸丁螺环酮。

2. 丁螺环酮(36505-84-7)的规格:

盐酸丁螺环酮:含不少于97.5%和不大于102.5%的C₂₁H₃₁N₅O₂·HCl;水分含量应不大于0.5%;炽灼残渣应不大于0.5%;重金属含量应不超过0.002%。

3. 药理学特征:

经对大鼠群居、改良强迫性游泳、高架十字迷宫实验模型试验表明,本品有良好抗焦虑作用,并有可逆性地减慢动物心率、降低平均脉压、增加呼吸频率及每分钟通气量的作用。无镇静、肌松作用。

4. 药代学特征:

据文献报道,本品口服很快完全吸收。食物可降低“首过效应”,提高生物利用度。本品血浆中达峰时间为40~90分钟,与血浆蛋白结合率为95%,广泛分布于体内。本品非常容易被代谢,主要代谢物大部分经肾脏(约65%)排泄,其余经粪便排泄,半衰期为2~3小时。

5. 适应症:

本品用于治疗广泛性焦虑症和其它焦虑性障碍。

6. 服用方法:

口服:开始一次5mg,一日2~3次。第二周可加至一次10mg,一日2~3次。常用治疗剂量一日20mg~40mg。

7. 不良反应:

包括头晕、头痛、恶心、呕吐、口干、便秘、失眠、食欲减退等。偶有心电图T波轻度改变及肝功异常。

8. 禁忌症:

- (1)孕妇、哺乳期妇女禁用。
- (2)儿童和对本品过敏者禁用。
- (3)青光眼、重症肌无力、白细胞减少及对本品过敏者禁用。

9. 注意事项:

- (1)心、肝、肾功能障碍者慎用。
- (2)老年人应减小剂量。
- (3)与单胺氧化酶抑制剂合用可致血压升高,切忌合用。
- (4)用药期间应定期检查肝功能与白细胞计数。
- (5)用药期间不宜驾驶车辆、操作机械或高空作业。服药期间勿饮酒。

10. 药物相互作用:

本品与单胺氧化酶抑制剂合用可致血压增高。

11. 规格:

5mg。

12. 有效期:

暂定二年。

13. 储藏:

遮光、密闭保存。

相关化学品信息

[36564-29-1](#) [36487-02-2](#) [水飞蓟宾\(水飞蓟宾A和水飞蓟宾B的混合物\)](#) [36475-50-0](#) [360069-21-2](#) [36124-03-5](#) [36303-31-](#)

8 二(三乙醇胺)钛酸二异丙酯 [3644-38-0](#) [36160-96-0](#) [365-12-8](#) [360065-37-8](#) [36505-48-3](#) [36497-11-7](#) [36417-16-](#)

0 447

生成时间2021/4/12 23:59:57