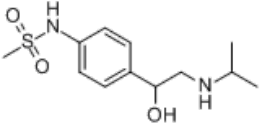




本PDF文件由 爱化学 iChemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[3930-20-9](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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: 3930-20-9 基本信息

中文名:	索他洛尔; 4'-(1-羟基-2-异丙胺乙基)甲磺酰苯胺
英文名:	Sotalol
别名:	N-[4-[1-Hydroxy-2-(isopropylamino)ethyl]phenyl]methanesulfonamide
分子结构:	
分子式:	C ₁₂ H ₂₀ N ₂ O ₃ S
分子量:	272.36
CAS登录号:	3930-20-9

物理化学性质

性质描述: 白色结晶

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: 穿戴合适的防护服装。

危险品标:  Xi: 刺激性物质

危险类别码: R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#3930-20-9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. 3930-20-9 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: 降血压药

生产方法及其他:

1. 索他洛尔(3930-20-9)的规格:

盐酸索他洛尔: 按干燥品计算, 含C₁₂H₂₀N₂O₃S·HCl不得少于99.0%和不得大于101.0%; 有关物质应符合规定; **硫酸**盐灰分不得大于0.1%; 干燥失重不得大于0.5%。

2. 索他洛尔(3930-20-9)的生产方法:

①在冰浴和搅拌下, 往**苯胺**、**三乙胺**和**乙醇**的溶液中, 滴加**甲磺酰氯**, 控制内温在-5~0℃。然后室温搅拌。过滤, 滤液浓缩至一半, 在约0℃析出晶体。滤集固体, **乙醇**重结晶, 烘干得**甲磺酰苯胺**, 收率84%。在冰浴和搅拌下, 往**甲磺酰苯胺**、**溴乙酰溴**和**二硫化碳**的溶液中, 加入无水**三氯化铝**, 控制内温在15℃以下。室温搅拌后回流。蒸除溶剂, 倾入水中。过滤, **乙醇**重结晶, 烘干, 得化合物(I), 收率96.6%。

②在-5℃左右和搅拌下, 将化合物(I)加入异**丙胺**的**甲醇**溶液中, 反应。减压浓缩, 加**丙酮**, 通入**氯化氢**至pH值为2。滤集固体, 无水**乙醇**重结晶, 得化合物(II), 收率65%。

③化合物(II)溶于甲醇, 加10%Pd-C, 通入氢气至不吸收为止。过滤, 滤液浓缩至干, 加甲醇热至全溶, 活性炭脱色。冷却, 过滤得白色的盐酸索他洛尔, 收率85%, 熔点206~207℃。

3. 临床应用:

本品吸收迅速, 与传统的抗心律失常药物相比, 能有效的抑制多种室性及室上性心律失常, 具有生物利用度高, 半衰期长的优点, 因而一直受到临床方面的高度重视及广泛采用。

4. 适用症:

本品用于治疗室性和室上性心律失常、高血压、心绞痛和心肌梗死后, 尤其适用于各种危及生命的室性快速型心律失常。

5. 用法及用量:

首次推荐剂量: 160mg/日(分两次服), 根据情况, 可隔周调整剂量, 有效剂量范围: 160~640mg/日。

静脉注射, 每次1.5-2.0mg/kg, 或每次20-60mg, 注射时间不少于10min。继以口服每次50-100mg, 每日2次。

6. 索他洛尔(3930-20-9)的不良反应:

静脉注射常见的副作用为低血压、心动过缓、传导阻滞, 其它不良反应为疲倦、呼吸困难、无力、眩晕。与其它抗心律失常药物相似, 本品在某些病人可产生致心律失常的不良反应, 即可以诱发新的心律失常或使已有的心律失常加重。其中包括诱发尖端扭转型室性心动过速。

7. 禁忌症:

当患者肌酐清除率小于60ml·h⁻¹时, 应慎用本品。禁用于支气管哮喘、窦性心动过缓、II度或III度房室传导阻滞(除非安放了有效的心脏起搏器)、先天性或获得性QT间期延长综合症、心源性休克、未控制的充血性心力衰竭以及对本品过敏的病人。

8. 药物相互作用:

(1) 本品能使QT间期延长, 故已知能延长QT间期的药物如I类抗心律失常药、酚噻嗪类、三环类抗抑郁药、特非那定等不宜与本品合用。

(2) 本品对地高辛血清浓度无明显影响, 但两者合用引起致心律失常作用较为常见。

(3) 本品与钙拮抗剂合用可产生相加作用而导致低血压, 故应谨慎合用。

(4) 本品与利血平、胍乙啶及其它有β-受体阻滞作用的药物合用可降低交感神经张力, 导致低血压和严重心动过缓, 甚至昏厥。

(5) 本品与异丙肾上腺素等β-受体激动剂合用时, 可能需要增加用药剂量。

9. 索他洛尔(3930-20-9)的注意事项:

(1) 避免与能延长QT间期的药物合用。

(2) 应用本品前应作电解质检查, 低血钾和低血镁患者应在纠正后再用本品; 对于长期腹泻或同时用利尿剂的患者尤需注意; 与排钾利尿剂合用时应注意补钾。

(3) 有支气管痉挛性疾病的患者避免使用本品。

(4) 伴有病窦综合症患者用本品时应特别谨慎, 谨防引起窦性心动过缓、窦性间歇或窦性停搏。

(5) 本品具有β-受体阻滞剂作用, 故可抑制心肌收缩力或引发心力衰竭。因此, 心功能不全患者在用洋地黄或利尿剂控制心功能不全后, 方可慎用本品; 另外, 两者均使房室传导延长、减慢心率, 应警惕其致心律失常作用。

(6) 本品禁用于有以下疾患的病人: 支气管哮喘或慢性阻塞性气道疾病, 对本品有过敏史, 心源性休克, 窦性心动过缓, 未控制的充血性心衰, 先天性或获得性QT间期延长综合症。

(7) 长期应用本品停药应慎重, 尤其对缺血性心脏病病人应作仔细的监测。

(8) β⁰阻断作用会进一步抑制心肌收缩性并使心衰加重。左心室功能不全的患者在治疗(如ACEI抑制剂、利尿剂、洋地黄等)开始时需谨慎, 宜从小剂量开始并小心调整剂量。

(9) 低钾血症或低镁血症患者在紊乱纠正前不应使用本品, 对严重或长期腹泻病人或同时服用排钾或排镁药物的病人, 应特别注意其电解质和酸碱平衡情况。

(10) QT间期过度延长, >550msec可作为中毒的指标, 应该避免发生。

(11) 病人在手术中以及使用了抑制心肌的麻醉药如环丙烷或三氯乙烷, 建议应谨慎使用本品。

(12) 糖尿病及甲状腺机能亢进病人慎用。

(13) 心功能不全患者在用洋地黄和/或利尿药控制心功能不全之后, 方可用本品。

10. 药理:

本品为唯一兼具有II类和III类电生理活性的抗心律失常药, 属非心脏选择性, 也无内源性拟交感活性或膜稳定活性的Ia类 β -受体阻滞药。可延长复极、动作电位时程、心房、心室、房室结和旁路的有效不应期。有明显的抗心肌缺血、提高致室颤阈值作用, 并具有抗颤动和抗交感作用。

11. 药动学:

口服吸收完全, 几达100%, 口服后2~3h达血浆峰值, 肝脏首过效应很小, 生物利用度为95%, 表观分布容积为1.6~2.4L/kg。在肝脏内几乎不被代谢, 血浆蛋白结合率为50%。有效血浆浓度为1~3 μ g/ml。长程口服血浆半减期为14~20h, 分布半减期为6.5h。肾功能衰竭时, 其半减期可长达42h。单剂静脉注射, 半减期则仅为6~8h。约75%经尿排出, 其余经胆汁排泄。

12. 索他洛尔(3930-20-9)的产品特点:

注射用盐酸索他洛尔:

(1) 广谱抗心律失常: 防治室上性心律失常: 心房扑动、心房颤动、室上性心动过速和预激综合症等 防治室性心律失常: 室性期前收缩、室性心动过速和心室颤动等。

(2) 生物利用度高: 注射吸收完全, 生物利用度接近100%, 尤其适用于危及生命的快速型室性心律失常。

(3) 临床治疗效果好: 治疗室上性心律失常: 疗效可与奎尼丁媲美, 而优于普罗帕酮、美托洛尔、丙吡胺、普鲁卡因胺、胺碘酮等。治疗室性心律失常: 疗效优于现有的I类、II类、III类和IV类所有的抗心律失常药。防止病人心律失常复发: 有效率比美西律、奎尼丁、普鲁卡因胺、吡美诺、普罗帕酮及米帕明等6种药的平均有效率高1倍。引起死亡危险的不良反应仅是这些药物的1/2。

(4) 药代学优越: 本品不经肝首过消除, 不与血浆蛋白结合, 心、肝、肾内浓度高, 无活性代谢产物, 消除半衰期较长。

(5) 安全性相对较好: 本品较II类药物具有更好的依从性, 比III类药胺碘酮毒副作用低。有临床试验3257例统计, 致心律失常发生率为4%, 低于II类抗心律失常药, 只要合理应用, 本品是目前抗心律失常药物中相对较为安全的药物。

13. 索他洛尔(3930-20-9)的功能主治:

用于防治偏头痛发作, 减轻甲亢患者的外周症状及甲状腺切除术前准备, 治疗灼性神经痛、红斑性肢痛病、阻塞型心肌病(静注)、二尖瓣脱垂症、急性肾功能衰竭、高动力型休克、痴呆及脑外伤患者的激惹状态、抗精神病药物所致的药源性静坐不能、焦虑症、精神分裂症、震颤、预防肝硬化门脉高压患者胃肠道出血、粘液性水肿、茶碱中毒、乙醇中毒、流行性出血热、体位性综合征、再生障碍性贫血、血卟啉症等。此外, 还可用于避孕(能阻止精子活动)和催产(能诱发子宫收缩)。滴眼剂可降低眼内压, 用于单纯性青光眼的治疗有较好的疗效。

14. 规格:

制剂: 片制: [铝塑板包装](#); 80mg ; 注射液: 80mg(盐酸盐); 针剂: 5mg/支。

15. 其它:

支气管哮喘、房室传导阻滞、心力衰竭、低血压症、肝功能减退者忌用。本品用量个体差异较大, 应从小剂量开始, 以探索个体有效剂量。是处方药。

16. 贮藏:

遮光, 密闭保存。

相关化学品信息

[1-\(3-羟基金刚烷-1-基\)乙酮](#) [39110-58-2](#) [398147-01-8](#) [39297-79-5](#) [39240-97-6](#) [39138-90-4](#) [39832-36-5](#) [3937-85-7](#)
[2,3-二氢-1,1,3-三甲基-3-苯基-1H-茚](#) [392328-15-3](#) [39635-02-4](#) [395645-41-7](#) [39885-24-0](#) [39880-80-3](#) [392-61-](#)

[0](#) 457

生成时间2021/1/15 0:47:56