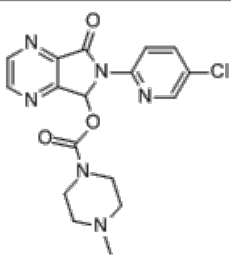





本PDF文件由 爱化学 免费提供, 全部信息请点击[43200-80-2](#), 若要查询其它化学品请登录CAS号查询网

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:43200-80-2 基本信息

中文名:	佐匹克隆; (5RS)-6-(5-氯吡啶-2-基)-7-[(4-甲基哌嗪-1-基)羰氧基]-5,6-二氢吡咯并[3,4-b]吡嗪-5-酮
英文名:	Zopiclone
别名:	4-Methyl-1-piperazinecarboxylic acid 6-(5-chloro-2-pyridinyl)-6,7-dihydro-7-oxo-5H-pyrrolo[3,4-b]pyrazin-5-yl ester; Imovane
分子结构:	
分子式:	C ₁₇ H ₁₇ ClN ₆ O ₃
分子量:	388.81
CAS登录号:	43200-80-2
EINECS登录号:	256-138-9

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:	 H302: 有害物质
危险类别码:	R62: 有削弱生殖能力的危险。 R20/21/22: 吸入、皮肤接触和不慎吞咽有害。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#43200-80-2化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

 Sigma-Aldrich 专业从事43200-80-2及其他化工产品的生产销售 800-736-3690
 上海共价化学科技有限公司 佐匹克隆专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 021-65566949
 大连美仑生物技术有限公司 长期供应(5RS)-6-(5-氯吡啶-2-基)-7-[(4-甲基哌嗪-1-基)羰氧基]-5,6-二氢吡咯并[3,4-b]吡嗪-5-酮等化学试剂, 欢迎垂询报价 0411-82593631、82593920
 湖北三元素生物科技有限公司 生产销售C₁₇H₁₇ClN₆O₃等化学产品, 欢迎订购 027-50669369
 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. 43200-80-2](#) 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:	佐匹克隆(43200-80-2)的用途: 该药是吡咯酮类镇静催眠药, 有催眠、镇静、抗焦虑、肌松和抗惊厥等作用, 作用较快。可用于失眠症的治疗, 特别是暂时性入睡困难和早醒的患者。由于对呼吸系统的抑制作用极小, 因而不影响次晨的精神活动和动作的
-------	--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

机敏性。还可用于麻醉前给药。

1. 佐匹克隆(43200-80-2)的规格:

按无溶剂计算, 含 $C_{17}H_{17}ClN_6O_3$ 不得少于98.5%和不得大于100.5%; $[\alpha]_D^{20} -0.05^\circ \sim +0.05^\circ$ (1.0g本品溶于100.0mL [二甲基甲酰胺](#)); 有关物质应符合规定; [异丙醇](#)含量不得大于0.7%; 含重金属不得大于0.001%; [硫酸](#)盐灰分不得大于0.1%。

2. 佐匹克隆(43200-80-2)的生产方法:

①吡嗪-2,3-二[酸](#)酐和2-氨基-5-[氯吡啶](#)溶于[乙腈](#), 回流。冷却, 抽滤, 洗涤, 干燥。得到的固体悬浮于水中, 用1mol/L [盐酸](#)酸化至pH值1。搅拌后抽滤, 水洗, 干燥, 得化合物(I), 收率92%。

②化合物(I)和乙酐一起回流。冷却, 抽滤, 洗涤, 干燥, 得化合物(II), 收率82%。

③化合物(II)溶于二氧六环: 水(19:1)溶液, 在13℃和激烈搅拌下, 缓慢加入[硼氢化钾](#)。倾入水中, 缓慢加入冰[乙酸](#), 抽滤, 水洗, 干燥, 再悬浮于[氯仿](#)中, 室温搅拌。抽滤, 洗涤, 干燥, 得化合物(III), 收率63%。

④化合物(III)溶于无水吡啶, 在-10℃和搅拌下, 加入4-甲基-1-哌嗪甲酰氯盐酸盐, 反应。然后升温至20℃, 倾入冰水中, 静置, 抽滤, 洗涤, 干燥, 得到的粗品经精制, 得白色粉末状的佐匹克隆(43200-80-2), 收率65%, 熔点174~177℃。

其中最后一步可如下进行: 2.4g的氯化钠溶于60ml无水二甲基甲酰胺中, 在-10℃下, 加入12g的6-(5-氯-2-吡啶基)-5-羟基-7-氧-5,6-二氢吡咯并[3,4-b]吡嗪溶于360ml无水二甲基甲酰胺所成的溶液。当气体逸出停止后, 在-10℃下, 加入8.1g1-氯羰基-4-甲基哌嗪溶于20ml的无水二甲基甲酰胺的溶液。继续搅拌3h, 并让温度缓慢升至20℃, 然后倾入1540ml冰水中。过滤结晶出的产物, 用150ml水及100ml异丙基醚洗涤。干燥后产物的熔点140℃。

该粗品可用下列方法提纯: 粗品溶于600ml [醋酸乙酯](#), 用直径4.2cm、装有250g [硅胶](#)的柱子进行柱层析。先用3200ml [醋酸乙酯](#), 然后用400ml [醋酸乙酯](#)和[甲醇](#)(19:1, 体积比)的混合溶液展开。2次展开的流出液均不要。再用800ml [醋酸乙酯](#)和[甲醇](#)(9:1, 体积比)的混合液、800ml [醋酸乙酯](#)和[甲醇](#)(4:1, 体积比)的混合液来展开。这2次展开的流出液合在一起, 减压浓缩至干, 得到熔点170℃的产品。用190ml [乙腈](#)和异丙基醚(1:1, 体积比)的混合液来重结晶, 得到该产物。熔点178℃。

3. 药效学:

化学上属于环吡咯酮类化合物, 但药理作用与[苯二氮卓](#)类相似, 作用于相同受体。动物试验和临床应用均显示有镇静催眠、抗焦虑、肌松和抗惊厥等作用, 口服7.5mg后慢波睡眠的比例增加, 快速眼动相睡眠并不减少。

4. 药动学:

口服后吸收迅速, 1.5~2小时血药浓度达峰值, 生物利用度约80%。药物迅速分布全身, 健康人的分布容积为100L/kg。血浆蛋白结合率低, 约为45%, 半衰期约5小时。重复给药无蓄积作用, 以代谢产物形式主要经肾脏排泄。

5. 药理作用:

该药为非苯二氮卓类催眠药, 能缩短入睡时间, 显著改善睡眠质量, 减少觉醒次数。由于其半减期短, 也无长时间作用的代谢产物, 因而次晨出现精神活动和精神敏感度影响较小。该药停药后无失眠反跳, 长期用药也不会体内蓄积。

该药口服后吸收迅速。45%的药物能与血浆蛋白结合, 其消除半减期为3.5~6h, 该药在肝脏广泛代谢, 主要的代谢物为N-去甲基佐匹克隆和佐匹克隆N-氧化物。前者没有活性, 后者稍有活性。两种代谢物均主要从尿中排出。此外还有少量该药在唾液中排出。合理服用该药等催眠药有利于身体健康。国家支持药房按需销售该药等催眠药以利于民众健康和药店效益。

6. 功能主治:

各种因素引起的失眠症, 包括时差、工作导致失眠及手术前焦虑导致失眠等。

7. 用法及用量:

口服: 成人常用7.5mg(1片), 睡前服用。老年人开始治疗时, 每次3.75mg(半片)睡前服用。必要时, 遵医嘱增加剂量到7.5mg(1片)睡前服用。肝脏机能不全者: 每次3.75mg(半片)睡前服用。人如果超大量服用催眠药可使睡眠时间延长, 但大多仍可自动苏醒。

8. 佐匹克隆(43200-80-2)的不良反应:

可有味苦、口干、宿醉、恶心、恶梦、胃痛、焦虑与头痛等。

睡前服可有残留之白天瞌睡, 口苦, 口干。间或有肌肉张力减低, 酒醉感。

少见有晨间嗜睡、疲倦及精神运动性功能的损害、口干、口苦、肌无力等不良反应。长期服药者突然停药会出现恶心、呕吐、焦虑、激动等戒断症状。

与剂量及患者的敏感性有关。偶见日间瞌睡、口苦、口干、肌无力、遗忘、醉态。有些人出现异常的易怒、好

斗、易受刺激或精神错乱、头痛、乏力，长期服药后突然停药会出现戒断症状(因药物半衰期短故出现较快)，可能有较轻的激动、焦虑、肌痛、震颤、反跳性失眠及恶梦、恶心及呕吐，罕见较重的痉挛、肌肉颤抖、神志模糊(往往继发于较轻的症状)。

9. 相互作用：

(1)动物体内即使高剂量亦未能证实本品有诱导酶活力的作用。

(2)与肌松药或其他中枢神经抑制药同用会增强镇静作用。

(3)与苯二氮卓类抗焦虑药或催眠药同用，戒断症状的出现可增加。

本药不宜与抗精神病药、肌肉松弛药及乙醇合用(绝对禁止饮酒)，以免产生不良反应。

10. 佐匹克隆(43200-80-2)的禁用慎用：

①对本品过敏、失代偿的呼吸功能不全与15岁以下的小儿禁用；

②泌入乳汁中药物与血浆中药物浓度变化相似，哺乳期妇女不宜使用；

③肌无力患者忌用。

对本品过敏者、呼吸代偿机能不全患者、幼儿患者禁用。不推荐孕妇及哺乳妇女使用。肌无力症者需在医疗监护下使用本品。

对本药过敏、严重呼吸功能不全者禁用；哺乳期妇女及15岁以下儿童不宜使用；孕妇、重症肌无力、呼吸功能不全，肝功能不全者慎用，应根据病情适当调整给药剂量，延长给药间隔。

11. 给药说明：

大剂量长期用药突然停药可引起戒断症状。

①应在临睡时口服；

②肝硬变患者因去甲基作用减慢，血浆清除能力明显降低，应调整剂量；

③动物实验表明对本品的依赖性小于地西洋，但仍不宜长期应用。

12. 规格：

片剂：每片7.5mg。

13. 储存与处理：

对水是稍微有危害的不要让未稀释或大量的产品接触地下水、水道或者污水系统，若无政府许可，勿将材料排入周围环境。常规情况下不会分解，没有危险反应。密封、阴凉、干燥保存。

14. 其他：

①疏水参数计算参考值(XlogP)：0.5；

②氢键供体数量：0；

③氢键受体数量：7；

④可旋转化学键数量：3；

⑤互变异构体数量：0；

⑥拓扑分子极性表面积(TPSA)：91.8。

相关化学品信息

[433-30-7](#) [435342-04-4](#) [439931-81-4](#) [三\(4-溴苯\)胺](#) [DL-亮氨酸甘氨酸甘氨酸](#) [2-氯-1,1,1,3,3,3-六氟丙烷](#) [430-61-5](#) [甲基戊烷](#) [普罗替林](#) [4-\(2'-吡啶基\)苯甲酸](#) [4357-57-7](#) [435345-44-1](#) [430-55-7](#) [435273-45-3](#) [4312-44-1](#) [438545-36-9](#) [4396-19-4](#) [4-吡啶-4-基苯甲酸](#) [4384-79-6](#) [4324-23-6](#) [433252-24-5](#) [436100-10-6](#) [439108-15-3](#) [4385-48-2](#) [438530-90-6](#) [438218-20-3](#) [烟酸-3,4-二氢-2,5,7,8-四甲基-2-\(4,8,12-三甲基十三烷基\)-2H-1-苯并吡喃-6-基酯](#) [4337-71-7](#) [43135-99-5](#) [436088-60-7](#)

生成时间2014-3-29 23:16:42