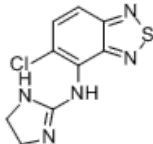




本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[51322-75-9](#), 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:51322-75-9 基本信息

中文名:	替扎尼定; 5-氯-4-(4,5-二氢-1H-咪唑-2-基)-2,1,3-苯并噻二唑-4-胺
英文名:	Tizanidine
别名:	5-Chloro-N-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-2,1,3-benzothiadiazole-4-amine; 4-Chloro-N-(4,5-dihydro-1H-imidazol-2-yl)-8-thia-7,9-diazabicyclo[4.3.0]nona-2,4,6,9-tetraen-5-amine
分子结构:	
分子式:	C <sub>9</sub> H <sub>8</sub> ClN <sub>5</sub> S
分子量:	253.71
CAS登录号:	51322-75-9

## 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。
危险类别码:	R22: 吞咽有害。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#51322-75-9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. 51322-75-9 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:	替扎尼定(51322-75-9)的用途: 它是 $\alpha_2$ -肾上腺素能(受体)激动剂。用于肌肉强直状态, 也可有效辅助预防日常慢性头痛, 包括偏头痛和紧张型头痛。
生产方法及其他:	1. 替扎尼定(51322-75-9)的生产方法: 在氮气保护和搅拌下, 将 <a href="#">对甲苯磺酸单水</a> 合物溶于 <a href="#">二甲苯</a> 和水中, 在50℃搅拌1h。加入 <a href="#">乙二胺</a> , 加热至95~96℃, 加入5- <a href="#">氯</a> -4-氧氨基-2,1,3- <a href="#">苯</a> 并噻二唑, 在100℃搅拌2h。加入水, 冷至40℃, 加入30% <a href="#">氢氧化钠</a> 溶液。冷至20~25℃, 过滤收集固体, 水洗, 真空干燥, 得产物替扎尼定(51322-75-9)。 2. 替扎尼定(51322-75-9)的功能主治: 本药为中枢性骨骼肌松弛药, 用于降低因脑和脊髓外伤、脑出血、脑炎以及多发性硬化病等所致的骨骼肌张力增高、肌痉挛和肌强直。 3. 替扎尼定(51322-75-9)的使用方法: 病人初次使用宜有2~4周的剂量调整期。开始用量每次2~4mg, 6~8小时1次。单剂用量一般不宜超过8mg, 而一日用量一般不宜超过24mg。最大用量为每日36mg。因本品口服有较强的首过效应, 使用时应注意剂量个体化。

#### 4. 药代动力学:

口服吸收良好,其绝对口服生物利用度为40%(变异系数CV=24%)。口服后达峰浓度的时间为1.5h(CV=40%);食物可使口服该药后的血药浓度峰值(C<sub>max</sub>)增加近1/3,使达峰时间缩短近40min,但是并不影响胃肠道对该药的总吸收。该药在体内分布广泛,健康志愿者静脉给药达稳态时的V<sub>d</sub>为2.4L/kg(CV=21%)。该药与血浆蛋白结合率约为30%,且在治疗剂量范围内无明显浓度依赖性。

肝脏对该药的首过消除作用较大,给药后约95%的药物经肝脏代谢,代谢产物无明显活性。该药血浆消除半衰期(T<sub>1/2</sub>)约为2.5h(CV=33%),其代谢产物的T<sub>1/2</sub>为20~40h。约20%的该药经肠道排出,60%以上的药物经肾脏排泄,其中原形排泄物仅为3%,肾功能不良明显影响该药的排泄;当肌酐清除率小于1.5L/h时,肾脏对该药的排泄速度降低50%以上,使该药的血浆消除半衰期平均延长达13.6h。

#### 5. 不良反应:

用于疼痛性肌痉挛的低剂量时,仅见轻微的一过性倦睡、疲劳、头晕、口干、恶心和血压轻微下降等。用于痉挛性麻痹时,因剂量较大,上述不良反应较常见且较明显,但不必停药。

具体的不良反应如下。

##### ①严重不良反应(发生机率不知):

(1)休克(低血压,心动过缓,面色苍白,出冷汗,呼吸困难等)(这种情况下应立即停药,采取适当的处置方法)。

(2)急剧的低血压:用药初期出现急剧血压下降(高龄患者及与降压药合用时应特别注意)。

(3)心功能不全(心肥大,肺水肿等)(这种情况下应立即停药,采取适当的处置方法)。

(4)呼吸障碍(喘鸣,气喘,呼吸困难等)(这种情况下应立即停药,采取适当的处置方法)。

(5)肝功能障碍(GPT和GOT显著升高,黄疸,恶心,呕吐,食欲不振,全身乏力等)(特别注意)。

##### ②其它不良反应循环系统:

(1)低血压(0.1~5%);心动过缓和心悸(不足0.1%)。

(2)神经精神系统:困倦、头痛、头沉、头晕和蹒跚(0.1~5%);知觉异常(麻木感)、口吃(语言不清)和失眠(不足0.1%)。

(3)消化系统:口渴、恶心、食欲不振、胃部不适、腹痛、腹泻(0.1~5%);胃消化不良、便秘、口腔炎、舌干裂、口味苦、流涎(不足0.1%)。

(4)肝功能:GPT和GOT升高(0.1~5%),ALP升高(不足0.1%)。

(5)过敏症:皮疹,皮肤瘙痒(0.1~5%),此时应立即停药。

(6)其他:上睑下垂(发生机率不知),乏力和倦怠(0.1~5%);浮肿和无尿(不足0.1%)。

#### 6. 药物相互作用:

用人肝微粒体细胞色素P450同功酶体外实验研究表明,本药及其代谢产物不影响该酶对其他药物的代谢。本药使扑热息痛的达峰时间推迟16分钟,而扑热息痛对该药的药动力学参数没有影响。[乙醇](#)使该药的曲线下面积增加约20%,使最大峰浓度增加15%,同时该药的不良反应增加,[乙醇](#)和该药的中枢神经系统抑制作用有相加作用。4mg该药单次或多次给予的回顾性研究表明,与没有同时服用口服避孕药的病人相比,同时服用口服避孕药使该药的清除率下降50%。

#### 7. 药理毒理:

该药为中枢性 $\alpha_2$ -肾上腺素受体激动剂,可能是通过增强运动神经元的突触前抑制作用而降低强直性痉挛状态。动物实验显示,该药对骨骼肌纤维和神经肌肉接头没有直接作用,对单突触脊髓反射的作用弱。该药对多突触通路的作用最强,这些作用被认为与脊髓运动神经元的易化性降低有关。

毒理研究的遗传毒性:该药Ames试验、哺乳动物基因突变试验、中国仓鼠细胞染色体畸变试验、小鼠骨髓微核试验、中国仓鼠骨髓微核试验和细胞遗传学试验、小鼠显性致死诱变试验和小鼠程序外DNA合成试验结果均为阴性。

生殖毒性:雄性大鼠给予该药10mg/kg,雌性大鼠3mg/kg(以mg/m<sup>2</sup>计算,分别相当于人最大推荐剂量的2.7倍和1倍),未见对生育力的影响。雄性大鼠给予该药30mg/kg、雌性大鼠10mg/kg时,生育力下降,母体出现镇静、体重减轻和运动失调等症状。大鼠给予该药3mg/kg、家兔30mg/kg(以mg/m<sup>2</sup>计算,分别相等于人最大推荐量的1倍和16倍),未见致畸作用。给予1~8倍于人最大推荐剂量的该药可延长大鼠的妊娠期,导致围产期幼鼠丢失增加、发育迟缓。家兔给予该药1mg/kg及更高剂量下,胚胎着床后丢失增加。

致癌性：小鼠经口给予该药剂量达16mg/kg，连续78周，大鼠经口给予该药剂量达9mg/kg，连续104周(按mg/m<sup>2</sup>计算，分别相当于人最大推荐量的2倍和2.5倍)，肿瘤发生率均未见显著增加。

8. 孕妇及哺乳期妇女用药：

本品孕妇及哺乳期妇女用药未充分评价，尚不知道该药是否通过乳汁分泌，但由于该药的脂溶性，有可能进入乳汁，故孕妇及哺乳期妇女用药应充分权衡利弊后，方可考虑。

9. 儿童用药：

儿童用药方面的安全性尚未充分评价。

10. 老年患者用药：

本品主要在肾脏进行排泄，所以在很多使肾功能低下的情况，对老年患者，此药可使血药浓度持续升高，故要注意减少用量；本品有降低血压的作用，老年患者用药应慎重。

11. 注意事项：

以下患者慎用：肝功能障碍患者：本品主要通过肝脏代谢，曾有致肝功能恶化的报道。肾功能不全患者：有服用本药经肾脏排泄缓慢，易维持较高的血药浓度的报道。重要的使用注意事项应注意使用初期可能引起急剧的血压下降。本药会引起反射运动能力降低和困倦，因此服药期间不宜从事驾驶或操纵机械等工作。

相关化学品信息									
<a href="#">4-(2,4-二特戊基苯氧基)丁胺</a>	<a href="#">51504-54-2</a>	<a href="#">514801-21-9</a>	<a href="#">51015-37-3</a>	<a href="#">苯磺酸乙酯</a>	<a href="#">511-26-2</a>	<a href="#">51048-16-9</a>	<a href="#">泰必利</a>	<a href="#">51934-38-4</a>	<a href="#">51285-58-6</a>
<a href="#">s,s-二(三甲基硅)乙二硫醇</a>	<a href="#">519054-53-6</a>	<a href="#">51-50-3</a>	<a href="#">51591-64-1</a>	<a href="#">51479-84-6</a>					427

生成时间2021/3/7 15:34:24