本PDF文件由 Lohemistry.cn 免费提供,全部信息请点击 <u>72522-13-5</u> ,若要查询其它化学品请登录 <u>CAS号查询网</u>	
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:72522-13-5 基本信息	
中文名:	依他佐辛; 益大素兴; 尹安佐辛; (1S)-2, 3, 4, 5, 6, 7-六氢-1, 4-二甲基-1, 6-亚甲基-1H-4-苯并偶氮宁-10-醇
英文名:	1,6-Methano-1H-4-benzazonin-10-ol,2,3,4,5,6,7-hexahydro-1,4-dimethyl-, (1S,6S)-
别名:	1, 6-Methano-1H-4-benzazonin-10-o1, 2, 3, 4, 5, 6, 7-hexahydro-1, 4-dimethyl-, (1S)-; (-)-1, 4-Dimethyl-10-hydroxy-2, 3, 4, 5, 6, 7-hexahydro-1, 6-methano-1H-4-benzazonine; (-)-Eptazocine; Eptazocine; Sedapain
分子结构:	HO
分子式:	$C_{15}H_{21}NO$
分子量:	231. 3333
CAS登录号:	72522-13-5
物理化学性质	
性质描述:	依他佐辛 (72522–13–5) 的性状: 1. 氢溴酸依他佐辛 (Eptazocine Hydrobromide) : $C1_5H_{21}N0 \cdot HBr$,白色结晶或结晶性粉末,无臭,味苦; 2. 易溶于水或甲醇,略溶于乙醇,难溶于冰醋酸或丙酮,几不溶于苯; 3. 熔点207~210℃; 4. 急性毒性LD $_{50}$ 雄、雌小鼠,雄、雌大鼠(mg/kg):124,166,980,540皮下注射;135,143,292,253肌肉注射;102,115,132,96腹腔注射;81,75,74,64静脉注射;310,500,460,320口服。
CAS#72522-13-5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. 72522-13-5 查看 若您是此化学品供应商,请按照 <u>化工产品收录</u> 说明进行免费添加	
其他信息	
产品应用:	依他佐辛 (72522-13-5) 对阿片受体有似 理激动剂的作用。用于各种癌及手术后的镇痛。
	1. 依他佐辛 (72522-13-5) 的生产方法: 4-甲基-4-(2-甲胺基乙基)-6-甲氧基四氢萘-1-酮和 <u>甲醛</u> 进行Mannich反应,所得产物进行催化氢化,然后用氢溴酸水解,得 依他佐辛 (72522-13-5)。 2. (1) 适应症 用于镇痛,尤其是癌痛及手术后疼痛。 (2) 规格 lml:15mg(以本药计) (3) 用法用量 成人一次肌注或皮下注射本药15mg,或遵医嘱,可根据症状酌量增减。 (4) 不良反应

①严重的不良反应

休克(发生率不到0.1%):虽然极少有休克的现象出现,但是在治疗期间还应小心观察病人,若有此现象出现 要马上停药,并采取适当的措施。

呼吸抑制,胸部压迫感(发生率0.1~5%): 偶有轻微的呼吸抑制或胸部压迫感。若有这些病症出现的话要采取相应措施(必要时吸氧或人工呼吸)或服用双吗林胺。服用烯丙左吗南及山梗菜碱则无效。

药物依赖:连续用大剂量本品可能会增加药物依赖危险性,不应超量,慎重给药。在连续服用大剂量时突然停药,可能会产生戒断综合症状,如震颤、恶心、心悸、冷感或失眠。

②其他不良反应(极少:发生率不到0.1%,偶有:发生率0.1~5%)

精神、神经系统: 偶有出汗,出冷汗,头晕,昏睡,头重脚轻,头痛。极少有头重感、不安感、不适感、激动、失眠、耳鸣、多语、肢体麻木。

消化系统: 偶有恶心、呕吐、口渴的感觉。极少有胃部不适感和打嗝。

心血管系统: 偶有燥热感、心悸。极少有脉频,面部泛红,血压上升、寒冷感。

注射处: 偶有注射部位疼痛感,极少有产生红肿和硬结的现象。

其他: 偶有不适感, 极少有发热和淋巴结肿胀。

(5) 禁忌

患有严重的呼吸抑制者。

患有颅脑外伤或颅内疾病易昏迷者。

颅内压增高者。

对本品所含成份过敏者。

- (6) 注意事项
- ①一般事项

恶心、呕吐、眩晕及头重脚轻可能发生,所以给门诊患者注射本剂后,应让其充分休息,在确认无异常后才可 使其回家。

由于可能出现嗜睡、眩晕及头轻脚重,应警告患者在注射本剂期间,不宜驾车、操纵机器及其他从事危险的工作。

②以下患者小心服用

有药物依赖史的患者。

有毒麻药品依赖的患者(戒断综合症状会发生,因本药在动物试验中有轻微的拮抗阿片受体的作用)。 有胆道疾病的患者(大剂量的本药在动物试验中会引起oddis括约肌挛缩)。

生产方法及其他:

③使用须知

肌注时要注意以免影响组织及神经系统

小心注射, 避开神经通过的地方。

连续注射要变换注射部位。

若当针头插入后,病人投诉有剧痛时,应立即拔出针头并另选注射点。

调配时:和巴比妥类制剂用的针筒混用的话,会有沉淀产生,所以应避免混用。

启盖:应用已浸过乙醇的棉花将瓶塞处消毒。

(7) 孕妇及哺乳期妇女用药

因对胎儿的安全性尚未确立,所以孕妇或可能怀孕的妇女在使用本药品时,应以其临床受益多于任何可能性风险为准则。

在小鼠动物实验中,有报道在哺乳母鼠的母乳内检测到本药,所以建议哺乳妇女应在服药期间停止授乳。有报道用类似本药品的病人在分娩时,新生婴儿有出现呼吸抑制的现象。

有报道在分娩前用类似本药品的妇女,生产出的婴儿有戒断综合症状出现,即紧张、震颤、呕吐。

- (8) 儿童用药: 儿童用药安全性尚未确立。
- (9) 老年患者用药

一般来说老年人的生理机能都比较低下, 所以应慎重给药。

(10) 药物相互作用

中枢性镇痛药(喷他佐辛、<u>盐酸</u>丁丙诺啡、<u>酒石酸</u>布托啡诺) 因有使本药作用增强的可能,必须合用时,应对 其中一种或两种减量慎重给药。镇痛药相同,对阿片受体有作用。 苯二氮杂卓衍生物及其它的镇静药(安定、硝基 安定、美达西泮等)、中枢抑制剂(镇静剂等)(巴比妥酸衍生物如苯巴比妥等)、<u>酒精</u>等 因有使本药作用增强的 可能,必须合用时,应对其中一种或两种减量慎重给药。伴随有中枢神经抑制的作用吗啡,因有使本药作用增强的可能,必须合用时,应对其中一种或两种减量慎重给药。另外,本剂在给药剂量高的情况下,对吗啡有拮抗作用。 本品与吗啡相同,对阿片受体有作用,本品可影响脑内阿片受体的饱和浓度。

(11) 药物毒理

药理作用

氢溴酸依他佐辛是一种中枢性镇痛药,通过与K阿片受体结合抑制痛觉传导。小鼠压痛试验、热板试验、<u>醋酸</u>扭体试验、电流刺激试验及大鼠抗缓激肽试验结果显示本药具有镇痛作用。

毒理研究

生殖毒性:一般生殖毒性试验中,小鼠皮下注射给予氢溴酸依他佐辛3~100mg/kg; 致畸敏感期试验中,小鼠皮下注射给予氢溴酸依他佐辛15~125mg/kg,家兔给予3~100mg/kg; 围产期毒性试验中,小鼠皮下注射给予氢溴酸依他佐辛3~100mg/kg,可见母鼠体重抑制,胎仔体重抑制、骨化延迟,未见畸形。

耐受性: 小鼠热板试验中结果显示,本药的耐受性较喷他佐辛和吗啡轻,产生耐受的速度较缓慢。

(12) 药代动力学

健康成人皮下或肌肉注射15mg本药20-30分钟后达到血中最高浓度。主要代谢物为本药的葡萄醛酸化合物及N-脱甲基物、9-双氢氧化合物及其结合物。主要排泄途径为肾脏,一般在服用后24小时内82.5%从尿中排出。

- (13) 贮藏: 避光, 密闭保存。
- (14) 有效期: 24个月。

相关化学品信息

 72570-96-8
 72310-28-2
 7227-94-3
 72220-14-5
 72018-12-3
 72678-87-6
 7226-34-8
 72071-75-1
 723340-87-2
 异丁烯基化[[[3-(二 甲氨基) 丙基] 氨基] 甲基] 苯酚

 3-氰基-2-甲氧基吡啶
 72028-62-7
 H-TYR-VAL-MET-GLY-HIS-PHE-ARG-TRP-ASP-ARG-PHE-NH2
 72799-41

 8
 72543-47-6
 490

生成时间2014-6-10 14:59:33