



本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[78628-80-5](#), 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](#)

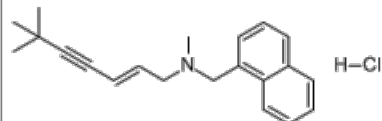
CAS Number:78628-80-5 基本信息

中文名: 盐酸特比萘芬;
 特比萘芬盐酸盐;
 (E)-N-(6,6-二甲基庚-2-烯-4-炔基)-N-甲基-1-萘甲胺盐酸盐

英文名: Terbinafine hydrochloride

别名: (E)-N-(6,6-Dimethyl-2-hepten-4-ynyl)-N-methyl-1-naphthalenemethanamine monohydrochloride

分子结构:



分子式: $C_{21}H_{26}ClN$

分子量: 327.89

CAS登录号: 78628-80-5

EINECS登录号: 245-385-8

物理化学性质

熔点: 204-208°C

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。
 S60: 本物质残余物和容器必须作为危险废物处理。
 S61: 避免排放到环境中。参考专门的说明 / 安全数据表。
 S36/37/39: 穿戴合适的防护服、手套并使用防护眼镜或者面罩。

危险类别码:

R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。
 R50/53: 对水生生物极毒, 可能导致对水生环境的长期不良影响。

CAS#78628-80-5化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

上海迈瑞尔化学技术有限公司 专业从事78628-80-5及其他化工产品的生产销售 0755-86170099
 萨恩化学技术(上海)有限公司 盐酸特比萘芬专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 021-58432009
 大连美仑生物技术有限公司 长期供应特比萘芬盐酸盐等化学试剂, 欢迎垂询报价 0411-82593631、82593920
 孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 生产销售(E)-N-(6,6-二甲基庚-2-烯-4-炔基)-N-甲基-1-萘甲胺盐酸盐等化学产品, 欢迎订购
 0712-2580635 15527768836
 将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 是以C21H26ClN为主的化工企业, 实力雄厚 021-61552785

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. 78628-80-5](#) 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:

特比萘芬(78628-80-5)的用途:

本品为烯丙胺类抗真菌药物, 其抗菌谱比萘替芬更广, 抗真菌活性更高。临床用于各种皮肤真菌感染(脚癣、股癣和体癣)和指甲真菌感染。能高选择性地抑制真菌的角鲨烯环氧化酶, 使真菌细胞膜形成过程中角鲨烯环氧化反应受阻, 而破坏真菌细胞膜的生成, 达到杀死或抑制真菌的作用。安全、毒性低、副作用小, 口服和外用耐受性好, 无致畸性或胚胎毒性。

	只需轻轻，
	特比萘芬(78628-80-5)的制备方法： 1. 以氯代叔丁烷和氯乙烷为原料，两者在三氯化铝存在下缩合。然后在氢氧化钾存在下，在二甲亚砜中高温加热，消去二分子的氯化氢，而得炔键。先和乙基溴化镁在室温中反应，再和丙烯醛作用生成6，6-二甲基庚-1-烯-4-炔-3-醇。最后溴代得顺反1-溴-6，6-二甲基庚-2-烯-4-炔，其E/Z约为3/1。 2. 上述得到的产物和N-甲基-1-萘甲胺在碳酸钠作用下缩合，得特比萘芬(74.5%)和它的顺式异构体(25.4%)。两者可以用异丙醇重结晶来分离，也可用柱层析分离(洗脱液为甲苯-EtOAc，9：1)。 一：片剂说明书 1. 特比萘芬(78628-80-5)的药理作用： 特比萘芬是一个丙烯胺类药物，对于皮肤、发和甲的致病性真菌包括皮肤癣菌，如毛癣菌(如红色毛癣菌、须癣毛癣菌、疣状毛癣菌、断发毛癣菌、紫色毛癣菌)、小孢子菌(如犬小孢子菌)、絮状表皮癣菌以及念珠菌属(如白念珠菌)和糠秕癣菌属的酵母菌均有广泛的抗真菌活性。对于酵母菌，根据菌种的不同而具有杀菌效应或抑菌效应。 特比萘芬特异地干扰真菌固醇生物合成的早期步骤，由此引起麦角固醇的缺乏以及角鲨烯在细胞内的积聚，从而导致真菌细胞死亡。特比萘芬通过抑制真菌细胞膜上的角鲨烯环氧化酶来发挥作用。角鲨烯环氧化酶与细胞色素P450系统无关系。特比萘芬不影响激素或其它药物的代谢。 口服给药时，皮肤、发和甲中的药物浓度均可达到杀真菌活性的水平。 2. 特比萘芬(78628-80-5)的药代动力学： 口服单剂量250 mg特比萘芬在2小时内达到血浆峰值，浓度为0.97 ug/mL。吸收半衰期为0.8小时，分布半衰期为4.6小时。食物对特比萘芬的生物利用度有中度影响，但并不需要因此而调整剂量。 特比萘芬与血浆蛋白结合紧密(99%)，它迅速经真皮弥散，聚集于亲脂性的角质层。特比萘芬也能经皮脂腺排泄，这样在毛囊、毛发和富含皮脂的皮肤达到高浓度。也有证据表明特比萘芬在开始治疗后第一周内即可以分布到甲板。 特比萘芬经过至少7种CYP异构酶，主要包括CYP2C9、CYP1A2、CYP3A4、CYP2C8及CYP2C19，迅速和广泛地代谢。生物转化后的代谢产物无抗真菌活性，主要经尿排出。终末清除半衰期是17小时，无体内蓄积的证据。特比萘芬的血浆稳态浓度无年龄依赖性的改变，但在肝功能或肾功能受损的患者中，清除率可能会降低，可引起特比萘芬的血浆水平升高。 对有肝脏疾病的患者，单剂量药代动力学研究表明，特比萘芬的清除率降低约50%。 3. 适应症： 由皮真菌如发癣菌(红色发癣菌、须疮癣菌、断发癣菌、莖色发癣菌)、犬小孢子菌和絮状表皮癣菌引起的皮肤、头发真菌感染。 本品仅用于治疗大面积、严重的(体癣、股癣、足癣、头癣)和念珠菌(如白色假丝酵母)引起的皮肤酵母菌感染，根据感染部位、严重性和范围考虑口服给药的必要性。皮真菌(丝状真菌)感染引起的甲癣。 4. 特比萘芬(78628-80-5)的用法用量： 根据感染的严重程度和适应症调整疗程。 1. 成人：250mg(1片)，每天1次。 2. 儿童体重20-40 kg (通常年龄5-12岁)：125 mg(半片)，每天1次。 3. 由于没有关于年龄小于2岁儿童口服特比萘芬的治疗经验，因此本品不被推荐用于这个年龄组。 4. 皮肤感染-推荐疗程：足癣(趾间，跖/托靴型)：2-6周。 5. 体癣、股癣：2-4周。 6. 皮肤念珠菌病：2-4周。 7. 感染症状和体征的消失可能到真菌学治愈后数周才出现。 8. 头发和头皮感染-推荐疗程：头癣：4周。头癣主要见于儿童。 9. 甲真菌病：对于大多数患者，成功的疗程为6-12周。 10. 指甲真菌病：大多数指甲真菌感染的病例，治疗疗程为6周。 11. 趾甲真菌病：大多数趾甲真菌感染的病例，治疗疗程为12周。 12. 一些甲生长不良的患者所需疗程较长。在真菌学治愈后及停止治疗后数月，常可见到良好的临床疗效，这与健甲长出所需时间相关。 5. 特比萘芬(78628-80-5)的不良反 出现频率估计：很常见≥ (greater than or equal to) 10%，1%≤ (smaller than or equal to) 常见

生产方法及其他:	<10%, 0.1%≤ (smaller than or equal to) 不常见<1%, 0.01%≤ (smaller than or equal to) 罕见<0.1%, 非常罕见<0.01%。 一般而言, 特比萘芬的耐受性好, 不良反应常为轻中度。最常见的是胃肠道症状(胀满感, 食欲降低, 消化不良, 恶心, 轻微腹痛, 腹泻), 轻微的皮肤反应(皮疹, 荨麻疹), 骨骼肌反应(关节痛, 肌痛)。 1. 不常见 : 味觉紊乱, 包括味觉丧失, 常常在停药后数周内可以恢复。 2. 罕见 : 有报告与特比萘芬治疗有关的肝胆功能不良(实际为原发性胆汁淤积性的), 包括非常罕见的肝衰竭。 3. 非常罕见 : 已报告的有严重的皮肤反应(如Steven-Johnson综合征, 中毒性表皮坏死)和过敏反应。如果有进行性的皮疹发生, 应终止特比萘芬治疗。 4. 非常罕见 : 已报告的有血液系统疾患如中性粒细胞减少症, 粒细胞缺乏症或血小板减少症。 5. 非常罕见 : 已报告的有脱发, 尽管病因关系尚未确定。 6. 禁忌症: 对盐酸特比萘芬及本品其它成份过敏者禁用。 7. 注意事项: 如果患者出现肝功能不良的体征或提示性症状, 如无法解释的恶心、厌食或疲倦、或黄疸、黑尿或无色粪便时, 应当确认是否为肝源性的, 并终止特比萘芬治疗。在已有肝病的患者中进行的单剂量药代动力学研究表明, 特比萘芬的清率降低50%, 在前瞻性的临床试验中未开展伴有慢性或活动性肝病的患者使用特比萘芬的研究, 因此不做推荐。 肾功能受损的患者(肌酐清除率不足50 mL/分钟或血肌酐超过300 mmol/L)应当服用正常剂量的一半。 体外研究表明特比萘芬抑制CYP2D6的代谢, 因此, 如果同时服用的药物的治疗窗较窄时, 应该对接受主要由该酶代谢的药物, 如三环类抗抑郁药(TCAs)、β-阻滞剂、选择性5羟色胺再摄取抑制剂(SSRIs)、以及单胺氧化酶抑制剂(MAO-Is)B型进行伴随治疗的患者, 进行监测。 8. 孕妇及哺乳期妇女用药: 胎儿毒性及生育能力动物实验研究发现, 无不良反应。由于妊娠妇女中的临床经验非常有限, 在妊娠期间, 如果服药的益处不能超过风险, 不应使用。特比萘芬可以分泌至乳汁当中; 因此口服特比萘芬治疗的母亲不应哺乳。 9. 儿童用药: 2岁以上的儿童口服特比萘芬耐受性好。 10. 老年患者用药: 尚无证据提示老年患者与年轻患者需服不同剂量或发生不同的不良反应。开处方时, 应当考虑到这一年龄组患者已存在肝、肾功能损害的可能性。 11. 特比萘芬(78628-80-5)的药物相互作用: 依照体外研究和健康志愿者中进行研究的结果, 特比萘芬有轻微的抑制或增加大多数经细胞色素P450系统代谢的药物的清除(如环孢素、特非那丁、三唑类、对甲苯磺酰基脲或口服避孕药)。 但是, 体外研究表明, 特比萘芬抑制CYP2D6介导的代谢, 这一体外实验的发现可能与那些主要由该酶代谢的化合物具有临床相关性, 如三环类抗抑郁药(TCAs)、β-阻滞剂、选择性5羟色胺再摄取抑制剂(SSRIs)、以及单胺氧化酶抑制剂(MAO-Is)B型, 因为它们也有较窄的治疗窗。在特比萘芬与口服避孕药合用的患者中, 已报告有月经不调的病例发生, 尽管其发生率仍然处于单独服用口服避孕药患者的发生率之内。另一方面, 一些代谢诱导性药物(如利福平)可以加速特比萘芬的血浆清除率, 另一些抑制细胞色素P450的药物(如西咪替丁)则可以抑制特比萘芬的血浆清除。如果有必要同时使用这些药物时, 特比萘芬的剂量应作相应的调整。 12. 药物过量: 已有少数药物过量(达到5g)的病例报告, 发生了头痛、恶心、上腹痛及头晕。药物过量的推荐治疗是清除药物, 主要是服用活性炭来治疗, 根据需要可针对症状给予支持治疗。 13. 贮藏/有效期: 密封、避光、30° C以下保存。有效期暂定3年。 二: 乳膏剂说明书 1. 作用类别: 本品为皮肤科用药类非处方药药品。 2. 适应症: 用于治疗手癣、足癣、体癣、股癣、花斑癣及皮肤念珠菌病等。
---------------------	--

3. 用法用量：
外用，一日2次，涂患处，并轻柔片刻。疗程1～2周。

4. 不良反应：
偶见皮肤刺激如烧灼感，或过敏反应如皮疹、瘙痒等。

5. 禁忌：
对本品过敏者禁用。

6. 特比萘芬(78628-80-5)的注意事项：
1、孕妇及哺乳期妇女慎用。
2、避免接触眼睛和其他黏膜（如口、鼻等）。
3、用药部位如有烧灼感、红肿等情况应停药，并将局部药物洗净，必要时向医师咨询。
4、本品涂敷后不必包扎。
5、不得用于皮肤破溃处。
6、对本品过敏者禁用，过敏体质者慎用。
7、本品性状发生改变时禁止使用。
8、请将本品放在儿童不能接触的地方。
9、儿童必须在成人监护下使用。
10、如正在使用其他药品，使用本品前请咨询医师或药师。

7. 药物相互作用：
如与其他药物同时使用可能会发生药物相互作用，详情请咨询医师或药师。

8. 特比萘芬(78628-80-5)的药理作用：
本品为广谱抗真菌药，能高度选择性地抑制真菌麦角鲨烯环氧化酶，阻断真菌细胞膜形成过程中的麦角鲨烯环氧化反应而干扰真菌固醇的早期生物合成，从而发挥抑制和杀灭真菌的作用。

9. 贮藏：
密闭，在阴凉处保存。

10. 包装：
[铝](#)质软管装，10g/支/盒，15g/支/盒。

11. 有效期：
36个月。

12. 参数：
1、氢键供体数量：1
2、氢键受体数量：1
3、可旋转化学键数量：5
4、拓扑分子极性表面积（TPSA）：3.2
5. 常温常压下稳定，远离氧化剂。存放在密封容器内，并放在阴凉，干燥处。储存的地方必须远离氧化剂。远离火源。通常对水是不危害的，若无政府许可，勿将材料排入周围环境。
只需轻轻，

相关化学品信息

[78859-34-4](#) [\(S\)-\(-\)-5-羟甲基-2\(5H\)-呋喃酮](#) [782420-52-4](#) [785741-40-4](#) [78246-09-0](#) [78854-43-0](#) [\(R\)-N-Cbz-3-哌啶甲酸](#) [784077-52-7](#) [786589-20-6](#) [786624-87-1](#) [78201-59-9](#) [78590-17-7](#) [盐酸依氟鸟氨酸](#) [78210-59-0](#) [78263-87-3](#) 458

生成时间2016-3-8 8:50:35