

爱化学  
Ichemistry.cn本PDF文件由爱化学免费提供，全部信息请点击[78755-81-4](#)，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:78755-81-4 基本信息

中文名:	氟马西尼; 8-氟-5,6-二氢-5-甲基-6-氧代-4H-咪唑并[1,5-a][1,4]苯并二氮杂卓-3-甲酸乙酯
英文名:	Flumazenil
别名:	Ethyl 8-fluoro-5-methyl-6-oxo-5,6-dihydro-4H-imidazo[1,5-a][1,4]benzodiazepine-3-carboxylate
分子结构:	
分子式:	C <sub>15</sub> H <sub>14</sub> FN <sub>3</sub> O <sub>3</sub>
分子量:	303.29
CAS登录号:	78755-81-4

## 物理化学性质

熔点:	201-203°C
水溶性:	128MG/L

## 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。 S27: 立刻除去所有污染衣物。 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。

## CAS#78755-81-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

大连美仑生物技术有限公司 专业从事78755-81-4及其他化工产品的生产销售 0411-82593631、82593920

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. 78755-81-4](#) 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:	<p><b>氟马西尼(78755-81-4)的用途:</b></p> <ol style="list-style-type: none"> <li>第一个<b>苯</b>并二氮杂卓类药物的拮抗剂，用于对抗苯并二氮杂卓类药物超剂量使用后的镇静作用及定向障碍，并具有抗惊厥活性和抗癫痫作用。</li> <li>也可用于氟烷麻醉后的恢复期及因<b>酒精</b>中毒所致肝硬化的脑病，作为原因不明的神志丧失的诊断药，用以鉴别苯二氮卓类及其它药物中毒或脑损伤。</li> <li>中枢神经系统兴奋药。</li> </ol>
	<p><b>氟马西尼(78755-81-4)的生产方法:</b></p> <p>5-氟靛红在<b>冰醋酸</b>和<b>浓硫酸</b>中，用30%<b>过氧化氢</b>氧化，得黄色固体的6-氟靛红<b>酸酐</b>，收率82%。然后和肌氨酸(即N-甲基<b>甘氨酸</b>)在二甲亚砜中，于100°C反应，得化合物(I)，收率80%。再在<b>氯仿</b>中，N, N-二甲基<b>苯胺</b>存在下，和</p>

三氯氧磷回流。氯化所得化合物(II)经处理后，在二甲基甲酰胺中，叔丁醇钠存在下，和氨基醋酸乙酯反应，得氟马西尼，收率40%，熔点200~203℃。

4-氟-2-(N-羧基氨基)苯甲酸和N-甲基甘氨酸环合，生成化合物(III)，再和2-氨基乙酸乙酯环合，得到氟马西尼。

#### 氟马西尼(78755-81-4)的用法用量：

静注，本品可用0.9%氯化钠、0.45%氯化钠-2.5%葡萄糖或5%葡萄糖输液稀释，也可与其他复苏术同时应用。麻醉后，初剂量为15s内静注0.2mg。加在开始静注后60s内未达到要求的清醒程度，可再注射0.1mg，必要时可每隔60s重复注射一次，直到总剂量达1mg。通常使用0.3~0.6mg。在给予本品前连用BDZ类数周的病人，快速注射本品可引起戒断症状，故应避免快速注射。如意外地出现成断症状，可缓慢静注安定5mg或咪达唑仑5mg。

急救，静注初剂量为0.3mg。加在60s未达到要求的清醒程度，可重复注射本品直到病人清醒或总剂量达2mg。如又出现倦睡，则静滴0.1~0.4mg/h是有用的。滴注速率应个别调节，直到达到要求的清醒程度。如病人曾长期接受高剂量的BDZ类药，采用个别调整的注射剂量并缓慢给药，并不会产生戒断症状。出现意外的过度刺激迹象，应静脉给予安定5mg或咪达唑仑5mg。如重复给予本品未能使意识及呼吸功能明显改善，应认为BDZ并非致病因素。

#### 氟马西尼(78755-81-4)的药理作用：

本品为苯二氮卓类(BDZ)选择性拮抗药。本品作用于脑BDZ受体，阻滞BDZ受体而并不产生BDZ药物的作用。对小鼠、大鼠、猫和猴的药理试验表明，本品能逆转BDZ类及对中枢神经系统BDZ受体具亲和性的非BDZ类药物(如佐匹克隆、三唑并噁唑类)的作用。此种拮抗作用亦见于人类。本品也能部分拮抗丙戊酸钠的抗惊厥作用。抗精神病药常能增加体内催乳激素的水平，而BDZ类安定药可使之降低。本品能拮抗此种降低催乳激素的作用，从另一个方面证明了本品具BDZ拮抗作用。对安定、劳拉西泮或三唑仑产生耐受性及躯体依赖性的猴、猫、大鼠和小鼠，使用本品后可产生戒断症状。

#### 生产方法及其他：

本品毒性有限，小鼠的急性LD<sub>50</sub>为4300mg/kg(口服)、4000mg/kg(腹腔注射)；大鼠为6000mg/kg(口服)，1360mg/kg(腹腔注射)。本品为具弱亲脂性的碱，与血浆蛋白质中度结合(约50%)。结合的血浆蛋白2/3为清蛋白。本品的平均消除半衰期为53min。稳态时的平均分布容积(V<sub>ss</sub>=0.95L/kg)，与结构近似的BDZ接近，说明药物的组织结合与分布相似。本品通过生物转化迅速消除，主要代谢物羧酸无药理活性，且经肾消除。本品与BDZ类药物同时给药时基本药动学参数不受影响。

#### 氟马西尼(78755-81-4)的适应症：

本品用于逆转BDZ类的中枢镇静作用。

1. 用于麻醉后：住院病人用BDZ类诱导和维持全身麻醉后可用本品终止其作用。门诊及住院病人进行短时间的诊断或治疗手术后，可终止BDZ的镇静作用。

2. 用于急救：作为BDZ类中毒的诊断药物，或排除BDZ中毒。作为原因不明的神志丧失的诊断药，用以鉴别BDZ、其他药物中毒或脑损伤。在药物过量服用时特异地逆转BDZ的中枢作用(为避免插管，或拔除插管，而用以恢复自主呼吸及神志)。

#### 氟马西尼(78755-81-4)的不良反应：

不良反应有恶心、呕吐、颜面潮红，也可出现头昏、激越、精神错乱；对癫痫患者有可能引起发作；对已产生苯二氮卓躯体依赖性的病人可能促发严重的戒断症状；对同时服用苯二氮卓和三环类抗抑郁药的病人可能引发癫痫发作和心律失常。

#### 氟马西尼(78755-81-4)的注意事项：

1. 滴注快可出现焦虑、心悸、恐惧等不适感，少数可见血压升高，心率加快。
2. 对本品过敏者禁用。
3. 妊娠、哺乳期妇女慎用。
4. 手术后外周肌松剂作用消失前慎用。禁用于对本品过敏的病人。动物研究虽未见胚胎毒性或致畸性，妊娠头3

个月不应使用本品，除非确有必要，授乳期必要时可给予本品，因原先摄入或给予的BDZ的作用可能重新出现，在给予本品后最初24h内应告诫病人，不得从事危险的机械操作或驾驶车辆。

5. 本品存在时并不改变BDZ的药动学。本品静注100mg也未见过量给药的症状。

6. 麻醉后手术结束时在外周肌肉松弛药的作用消失之前，不应注射本品。

#### 相关化学品信息

[787522-21-8](#) [786606-22-2](#) [78818-78-7](#) [780820-78-2](#) [78448-10-9](#) [78338-31-5](#) [78957-08-1](#) [782431-83-8](#) [78859-46-8](#) [78219-42-8](#) [4-\(乙酰苯基\)苯甲烷](#) [N-甲氨基-N-甲基乙酰胺](#) [789-46-8](#) [785716-09-8](#) [78281-08-0](#) 443

生成时间2014-2-26 22:20:41