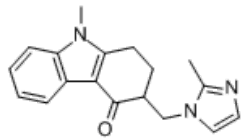




本PDF文件由 爱化学 ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[99614-02-5](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:99614-02-5 基本信息

中文名:	恩丹西酮; 昂旦司琼; 1,2,3,9-四氢-9-甲基-3-[(2-甲基-1H-咪唑-1-基)甲基]-4H-咪唑-4-酮
英文名:	Ondansetron
别名:	1,2,3,4-Tetrahydro-9-methyl-3-(2-methyl-1H-imidazol-1-ylmethyl)carbazol-4-one
分子结构:	
分子式:	C ₁₈ H ₁₉ N ₃ O
分子量:	293.36
CAS登录号:	99614-02-5

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。 S45: 出现意外或者感到不适, 立刻到医生那里寻求帮助 (最好带去产品容器标签)。 S37/39: 使用合适的手套和防护眼镜或者面罩。
危险类别码:	R25: 吞咽有毒。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#99614-02-5化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

江苏信达医药科技有限公司 专业从事99614-02-5及其他化工产品的生产销售 86-512-63009836

将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 恩丹西酮专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 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. 99614-02-5](#) 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:	恩丹西酮(99614-02-5)的用途: 其为5-羟色胺(5-HT ₃)受体拮抗剂, 高效镇吐药, 有高的强度和高度的选择性, 能控制小肠及CTZ(化学受体发动中心)中受体受刺激而引起的呕吐。适用于治疗由化疗和放疗引起的恶心呕吐, 也可用于预防和治疗手术后引起的恶心呕吐。
生产方法及其他:	恩丹西酮(99614-02-5)的制备方法: 方法一: 2-溴苯胺和1,3-环己二酮反应后, 再脱溴化氢环合, 生成四氢咪唑衍生物, 和二甲基胺及二聚甲醛反应, 在2位引入二甲氨基甲基, 得化合物(III)。3.80g化合物(III)和碘甲烷反应, 在9位引入甲基的同时对侧链氨基季铵化, 得到5.72g化合物(IV)。2.0g化合物(IV)和2-甲基-1H-咪唑在二甲基甲酰胺中, 于95℃搅拌反应, 得到0.60g昂丹司琼。 方法二: 环己酮和苯肼反应, 得四氢咪唑, 收率85%。将其溶于四氢呋喃和水中, 在氮气中, 于0℃滴加2,3,5,6-四氢-1,4-苯醌的四氢呋喃溶液, 搅拌得氧化产物(II), 收率67.4%。化合物(II)、乙醇、浓盐酸、多聚

甲醛和盐酸二甲胺，一起回流。处理后再在丙酮中，加浓盐酸在50℃搅拌，得氨甲基化产物(V)，收率71.7%。化合物(V)和2-甲基咪唑在水中，于110℃反应，得化合物(VI)，收率70.9%。化合物(VI)、碘甲烷和碳酸铷，在室温搅拌至固体消失。倾入水中，搅拌，过滤，水洗，甲醇重结晶，得昂丹司琼，收率57.2%。将其溶于丙酮和水的混合液中，加入浓盐酸反应，可得盐酸昂丹司琼二水合物，收率92.6%。

方法三：化合物(II)、碳酸钾、丙酮和硫酸二甲酯，室温搅拌。得化合物(VII)，收率91%。化合物(VII)溶于乙醇，在回流下分批加入聚甲醛和盐酸二甲胺的混合物。加毕，回流。经处理后，得化合物(VIII)，收率67%。(VIII)溶于无水乙醇，通入氯化氢气体，得其盐酸盐。将该盐酸盐加到水中，在50℃加入2. 甲基咪唑，回流得昂丹司琼，收率70%。将其溶于异丙醇、水和浓盐酸中，室温搅拌，得盐酸昂丹司琼二水合物，收率90.5%。

药理：

一般认为，化疗和放疗可引起小肠的嗜铬细胞释放5-HT₃，并通过5-HT₃受体引起迷走传入神经兴奋从而导致呕吐反射，而昂丹司琼可阻断这一反射发生。本品为一种高度选择性的5-羟色胺₃(5-HT₃)受体拮抗剂，能抑制由化疗和放疗引起的恶心呕吐，其作用机制目前尚不完全清楚。

恩丹西酮无镇静作用，不影响行为效率，且不改变血浆催乳素水平。口服吸收迅速，单剂量8mg，t_{max}为1.5小时，C_{max}为30ng/ml，口服生物利用度约为60%；V_d约为140L，t_{1/2β}约3小时；血浆蛋白结合率为70%~76%。主要自肝脏代谢，代谢产物主要自粪和尿排泄，50%以内的本品以原形自尿排出。老年人由于代谢减慢，服用本品后消除半衰期延长(5小时)，同时口服生物利用度提高(65%)；严重肝功能障碍患者系统清除率可显著减少，消除半衰期可延长至15~32小时，同时口服生物利用度可接近100%。

使用方法：

1. 预防或治疗手术后呕吐：

(1) 成人：一般可于麻醉诱导同时静脉滴注4mg，或于麻醉前1小时口服8mg，之后每隔8小时口服8mg，共2次。已出现术后恶心呕吐时，可缓慢滴注4mg进行治疗。

(2) 肾衰竭病人：不需调整用药次数、剂量或用药途径。

(3) 肝脏衰竭病人：由于本品主要自肝脏代谢，对中度或严重肝功能障碍病人每日用药剂量不应超过8mg。

2. 治疗由化疗和放疗引起的恶心呕吐：

(1) 成人：给药途径和剂量应视病人情况因人而异。剂量一般为8~32mg；对可引起中度呕吐的化疗和放疗，应在病人接受治疗前，缓慢静脉注射8mg；或在治疗前1~2小时口服8mg，之后间隔12小时口服8mg。对可引起严重呕吐的化疗和放疗，可于治疗前缓慢静注本品8mg，之后间隔2~4小时再缓慢静注8mg，共2次；也可将本品加入50~100ml生理盐水中于化疗前静脉滴注，滴注时间为15分钟。对可能引起严重呕吐的化疗，也可于治疗前将本品与20mg地塞米松磷酸钠合用静脉滴注，以增强本品的疗效。对于上述疗法，为避免治疗后24小时出现恶心呕吐，均应持续让病人服药，每次8mg，每日2次，连服5天。

(2) 儿童：化疗前按体表面积计算，每米²静脉注射5mg，12小时后再口服4mg，化疗后应持续给予病儿口服4mg，每日两次，连服5天。

(3) 老年人：可依成年人给药法给药，一般不需调整。

3. 静脉滴注时，本品在下述溶液中是稳定的(在室温或冰箱中可保持稳定1周)：0.9%氯化钠注射液、5%葡萄糖注射液、复方氯化钠注射液和10%甘露醇注射液，但本品仍应于临用前配制。

制剂：

片剂：每片4mg；8mg。注射液：每支4mg(1ml)；8mg(2ml)。

注意：

本品对动物无致畸作用，但对人类无此经验，故应十分谨慎。由于本品可经乳汁分泌，故哺乳妇女服用本品时应停止哺乳。有过敏史或对本品过敏者不得使用。怀孕期间(尤其头3个月)除非用药的益处大大超过可能引起的危险，否则不宜使用本品。

常见副作用有头痛、头部和上腹部发热感、静坐不能、腹泻、发疹、急性张力障碍性反应、便秘等；部分病人可有短暂性氨基转移酶升高；罕见副作用有支气管痉挛、心动过速、胸痛、低钾血症、心电图改变和癫痫大发作。

对肾脏损害患者，无需调整剂量、用药次数和用药途径。对肝功能损害患者，肝功能中度或严重损害患者体内廓清本品的能力显著下降，血清半衰期也显著延长，因此，用药剂量每日不应超过8mg。腹部手术后不宜使用本品，以免掩盖回肠或胃扩张症状。

药代动力学：

口服本品约2小时左右达血浆峰浓度，其生物利用度大约为60%（老年人则更高）。口服或静脉给药时，本品的体内情况大致相同，其消除半衰期约3小时。老年人可能延长至5小时。药物彻底代谢，代谢物经肾脏（75%）与肝脏（25%）排泄。血浆蛋白结合率为75%。

主要适应症：

止吐药。用于：①预防和治疗手术后的恶性呕吐；②细胞毒性药物化疗和放射治疗引起的恶心呕吐。

用法和用量：

1. 对于高度催吐的化疗药引起的呕吐：化疗前15分钟、化疗后4小时、8小时各静脉注射恩丹西酮注射液8mg，停止化疗以后每8~12小时口服恩丹西酮片8mg，连用5天。

2. 对催吐程度不太强的化疗药引起的呕吐：化疗前15分钟静脉注射恩丹西酮注射液8mg，以后每8~12小时口服恩丹西酮片8mg，连用5天。

3. 对于放射治疗引起的呕吐：首剂须于放疗前1~2小时口服片剂8mg，以后每8小时口服8mg，疗程视放疗的疗程而定。

4. 对于预防手术后的恶心呕吐：在麻醉前1小时口服片剂8mg，随后每隔8小时口服片剂8mg两次。

孕妇以及哺乳期妇女用药：

实验显示，本品可由授乳动物乳汁中分泌，故服用本品时暂停母乳喂养。本品在人类怀孕期间使用的安全性尚未确定。对动物试验研究未显示对胚胎期、胎儿期、妊娠期、围产期及产后期有直接或间接害处。然而，由于对动物的研究并不完全能够预示人的反应，故不推荐人在怀孕期特别是妊娠头3月使用本品。

药物的相互作用：

1. 没有证据表明本品会诱导或抑制其它同时服用药物的代谢。有专门研究表明，本品与酒精、替马西泮、咪塞米、曲马多及丙泊酚无相互作用。

2. 对司巴丁及异喹胍代谢差的患者，对本品消除的半衰期无影响。对这类患者重复给药后，药物的暴露水平与正常人体无差异，故用药剂量和用药次数不须改变。

3. 与地塞米松合用可加强止吐效果。

药物过量会产生现象：

对本品无特异的解毒药，当怀疑用药过量时，应适当地采取对症疗法和支持疗法。用药过量后会出现下列现象：视觉障碍、严重便秘、低血压及迷走神经节短暂二级AV阻滞。这些现象可得到完全纠正。不推荐用吐根治疗本品用药过量，因为患者会因本品自身具有的止吐作用，而不反应。

相关化学品信息

[99247-33-3](#) [99797-07-6](#) [99261-88-8](#) [99669-38-2](#) [2-氟-5-溴苄溴](#) [99418-85-6](#) [99368-19-1](#) [99430-49-6](#) [995-14-](#)
[2](#) [99585-97-4](#) [99901-15-2](#) [99012-36-9](#) [C. I. 活性蓝237](#) [间氨基苯乙酮](#) [99295-33-7](#) 423

生成时间2021/3/9 17:30:21