

本PDF文件由爱化学免费提供，全部信息请点击[123040-69-7](#)，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:123040-69-7 基本信息

中文名:	盐酸阿扎司琼; N-(1-氮杂双环[2,2,2]辛-3-基)-6-氯-4-甲基-3-氧代-3,4-二氢-2H-1,4-苯并恶嗪-8-甲酰胺盐酸盐
英文名:	Azasetron hydrochloride
别名:	N-1-Azabicyclo[2.2.2]oct-3-yl-6-chloro-3,4-dihydro-4-methyl-3-oxo-2H-1,4-benzoxazine-8-carboxamide hydrochloride
分子结构:	
分子式:	C ₁₇ H ₂₁ Cl ₂ N ₃ O ₃
分子量:	386.27
CAS登录号:	123040-69-7

物理化学性质

性质描述:	阿扎司琼(123040-69-7)的化学性质: 盐酸阿扎司琼: 从氯化氢的乙醇溶液中结晶, 熔点281℃(分解)。 有从乙醇中结晶, 熔点305℃(分解)。 急性毒性LD ₅₀ 雄大鼠, 雌大鼠(mg/kg): 135, 132静脉注射。
-------	---

CAS#123040-69-7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123040-69-7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. 123040-69-7 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:	抗肿瘤药。
	<p>阿扎司琼(123040-69-7)的生产方法: 5-氯-2-羟基苯甲酸甲酯(I)在硫酸液中用硝酸硝化, 生成硝化物(II), 然后在水中用铁粉和氯化铵还原为胺(III)。接着和氯乙酰氯, 在碳酸氢钠作用下, 在氯仿-水混合液中酰化并环合, 生成化合物(IV)。(IV)在二甲基甲酰胺中, 碳酸钾存在下, 用碘甲烷甲基化为化合物(V)。接着水解为羧酸(VI), 和氯化亚砜回流生成酰氯(VII), 最后在含N-甲基吗啉(MML)的氯仿中和3-氨基奎宁缩合, 即得阿扎司琼。</p> <p>阿扎司琼(123040-69-7)的药理: 本品为5-羟色胺3型(5-HT3)受体拮抗剂类止吐药。它具有强效、选择性地拮抗5-HT3受体的作用, 而没有多巴胺受体拮抗作用。本品与5-HT3受体有高度亲和力, 作用强度较甲氧氯普胺(Metoclopramide)强约410倍, 为奥坦西隆(Ondansetron)2倍, 几乎与格雷西隆(Granisetron)等同。本品静脉注入机体后, 能高度拮抗5-羟色胺(5-HT)诱发的心动过缓(即Bezold=Jarisch反射, 是5-HT3受体兴奋作用的表现), 本品的拮抗作用比甲氧氯普胺强约900倍, 比奥坦西隆强约4倍, 与格雷西隆等同。此外, 在感觉神经细胞、离体心脏或离体回肠的离体试验中, 本品显示对5-HT3受体的拮抗作用, 该作用较甲氧氯普胺强20~720倍, 比格雷西隆强1/8~3倍。</p>

体内或体外试验表明本品对其它受体的亲和力很小或几乎没有。与甲氧氯普胺相比，本品对5-HT3受体亲和力强而对组胺H1受体的亲和力小。本品浓度高达 $10\mu\text{mol/L}$ 时也未能测出与5-HT1A, 5-HT2, 多巴胺受体D₁、D₂, 肾上腺素受体- α_1 或 α_2 及毒蕈碱受体的亲和力。

本品静注0.1mg/kg或0.3mg/kg, 对顺铂(Cisplatin)或阿霉素(Doxorubicin)/环磷酰胺(Cyclophosphamide)所致狗的呕吐有止吐作用；0.3mg/kg几乎完全抑制顺铂所致呕吐，并且止吐作用约持续24小时。此外，本品静注0.3mg/kg几乎完全抑制放疗引起的狗呕吐。本品止吐作用强度与奥坦西隆或格雷西隆相比为同等或稍强些。本品拮抗由顺铂引起的摄食量减少而促进胃排空的胃运动，使受顺铂抑制的胃排空及胃运动趋向恢复状态。

一般药理试验中给狗静注本品10mg/kg剂量可抑制呕吐，30mg/kg剂量使半数狗不发生呕吐。小鼠给予本品30mg/kg或在豚鼠离体器官试验中本品浓度为万分之一(mol/L)时未见对中枢神经系统、植物神经系统等神经系统影响。本品对呼吸循环系统方面影响仅见轻度增强乙酰胆碱收缩豚鼠气管平滑肌作用；狗静注本品10mg/kg见血压轻度降低。30mg/kg剂量未引起其它方面如炎症或过敏反应，血液、糖或脂肪代谢以及消化系统未见异常。

阿扎司琼(123040-69-7)的药动学：

对大鼠、狗和人检测了本品的药代动力学。在机体内本品的未变化体及放射能标记体的血浓度与剂量均呈直线形关系。以同等剂量给予狗或大鼠，狗的血药—时间曲线下面积(AUC)明显大于大鼠的AUC，认为这种差异是动物种族属全身清除率的差别所致。大鼠静注本品单次后24小时及静注本品7次后72小时均未见本品在组织内的积蓄。大鼠血浆蛋白结合率43%~45%，无随时间变化而变化。狗静注本品后10分钟~6小时血浆蛋白结合率由4.3%上升至71%。本品代谢途径为脱甲基化、氮杂二环辛烷环上氮被氧化、苯环羟基化。本品自尿排泄，大鼠为45%、狗为62%，由粪排泄大鼠为53%、狗为35%，狗的尿排泄率较高。本品高浓度地向大鼠乳汁移行，然后迅速消失。

阿扎司琼(123040-69-7)的适应症：

适用于治疗由服用抗恶性肿瘤药(顺铂等)引起的恶心、呕吐等消化道症状。

阿扎司琼(123040-69-7)的用法用量：

成人常用量为：静脉注射，一日1次10mg。

阿扎司琼(123040-69-7)的制剂与规格：

注射剂：每支安瓿含本品10mg。

阿扎司琼(123040-69-7)的禁用慎用：

本品主要自肾脏排泄，因老年人肾功能减退，使用本品后持续血药浓度较高，可能易出现头痛、头重等不良反应。故老年人使用时须注意观察其状态，一旦发生不良反应，应减量(例如减至5mg)。

根据动物生殖毒性试验结果，孕妇或哺乳妇女应慎用。

小儿使用的安全性尚未确立，故小儿禁用。

阿扎司琼(123040-69-7)的给药说明：

本品只限用于治疗抗恶性肿瘤药(顺铂等)引起的恶心、呕吐。

本品使用时要注意以下几点：本品见光易分解，启封后应立即使用，注意避光。为了避免混入异物，使用前用酒精棉球擦清本品安瓿折断处；本品与碱性注射剂如呋喃苯胺酸(Furosemide)注射剂、甲氨蝶呤(Methotrexate)注射剂、氟尿嘧啶(Fluorouracil)注射剂混合易发生混浊或析出结晶，故应该用生理盐水与本品混合使用。

阿扎司琼(123040-69-7)的不良反应：

- (1) 神经系统方面偶有头痛、头重、焦虑、烦躁感。
- (2) 消化系统偶有口渴。
- (3) 循环系统偶有脸部苍白、冷觉、心慌。

- (4)肝脏偶有GOT、GPT值升高。
(5)皮肤偶有发疹。
(6)其它：偶有发热、畏寒、疲倦感、双足痉挛。

阿扎司琼(123040-69-7)的相互作用：

本品与碱性注射剂如呋喃苯胺酸(Furosemide)注射剂、甲氨蝶呤(Methotrexate)注射剂、氟尿嘧啶(Flurouracil)注射剂混合易发生混浊或析出结晶，故应该用生理盐水与本品混合使用。

相关化学品信息

2-(二异丙基甲硅烷基)嘧啶 126077-91-6 121279-73-0 127028-21-1 苯甲酰基二羰基(N5-2,4-环戊二烯-1-基)铁 2-溴-2',3',4',5',6'-五氟苯乙酮 1246355-58-7 9,10-二氰基蒽 129214-97-7 2,2-双(4-羟基-3-氨基苯基)丙烷 122323-85-7 125722-16-9 127332-96-1 120278-22-0 127411-75-0 497

生成时间2016-7-27 22:26:54