



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:83366-66-9 基本信息

中文名:	奈法唑酮; 2-[3-[4-(3-氯苯基)-1-哌嗪基]丙基]-5-乙基-2,4-二氢-4-(2-苯氧乙基)-3H-1,2,4-三唑-3-酮
英文名:	Nefazodone
别名:	2-[3-[4-(3-Chlorophenyl)-1-piperazinyl]propyl]-5-ethyl-2,4-dihydro-4-(2-phenoxyethyl)-3H-1,2,4-triazol-3-one
分子结构:	
分子式:	C ₂₅ H ₃₂ ClN ₅ O ₂
分子量:	470.01
CAS登录号:	83366-66-9

安全信息

安全说明:	S22: 不要吸入粉尘。 S24/25: 防止皮肤和眼睛接触。
-------	------------------------------------

CAS#83366-66-9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. 83366-66-9](#) 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>奈法唑酮(83366-66-9)的用途: 该药是抗抑郁剂。为苯基哌嗪类衍生物, 对5-HT具有双重作用。</p>
	<p>1. 奈法唑酮(83366-66-9)的生产方法: 3-哌嗪基氯苯和1-溴-3-氯丙烷反应, 得到N-烷化的产物。该胖烷化物用肼处理后, 再和(巯代丙酰胺基)甲酸乙酯在乙醇中反应, 生成三唑衍生物。该三唑衍生物在氢氧化钠作用下, 用苯氧基乙基溴进行N-烷化反应, 得到奈法唑酮(83366-66-9)。</p> <p>2. 奈法唑酮(83366-66-9)的药理作用: 本品为抗抑郁药物中新一代的选择性5-羟色胺重摄取抑制剂(SSRI)中的第一个新产品。本品是苯基哌嗪衍生物, 在生物化学和药理学方面明显不同于其它抗抑郁药。 该药具有双重作用模式, 能阻滞5-羟色胺再吸收及突触后5-HT₂受体。故可使5-羟色胺水平提高并通过5-HT1A受体有利于神经传递。因此, 本品既为5-HT2受体拮抗剂, 也阻断5-HT重摄人, 以及通过抑制突触前的去甲肾上腺素自体受体(autoreceptors)抑制去甲肾上腺素摄入。 一般认为本品是治疗抑郁症的一种新的和有效的途径, 它同时作用于5-羟色胺和去甲肾上腺素递质。临床前的研究显示: 本品虽抑制去甲肾上腺素再吸收和拮抗α₁-肾上腺素能受体, 但这些作用较轻。最强的药理作用是阻断5-HT₂受体。而这种受体兴奋则会产生睡眠紊乱、激动和自杀念头。阻断5-HT₂受体是本品耐受性改善的原因, 其耐受性与SSRI典型的不良反应有关。</p> <p>3. 奈法唑酮(83366-66-9)的动力学: 本品口服后, 吸收迅速、完全, 但在肝内经历广泛的首过代谢, 绝对生物利用度约20%。食物延迟本品吸收, 并减少生物利用度约20%, 但临床意义不大。其最重要的代谢物是羟基奈法唑酮, 也发挥着在质和量上都类似于该药的药理</p>

作用。

4. 适应症:

适用于抗抑郁症。

5. 用法用量:

口服，初剂量每日200mg，分2次服。根据临床效果和病人耐受性，每日剂量可增加100~200mg，但间隔不少于1周。有效剂量范围是每日300~600mg。老人或虚弱病人的初剂量是每日100mg，分2次服。

生产方法及其他：

本品的全部疗效在初期治疗数周后才出现，因此对于急性抑郁发作的治疗一般要持续6个月以上。

6. 不良反应:

包括神经系统作用(例如：思睡25%，头晕17%，头昏10%，精神错乱7%)，胃肠道症状(例如：恶心22%，便秘14%，口干25%，虚弱11%)，视力模糊9%，视觉异常7%等。临床试验中，36%的病人发生头痛，同安慰剂组33%的发生率相当。

本品的副作用倾向于6周后减少。在同丙米嗪的比较研究中本品具有较好的耐受性，口干、震颤和性功能障碍的发生率低，该药组因不良反应而中断治疗的为16%，丙米嗪组为20%，而安慰剂组为1%。

本品忧虑、兴奋和失眠等不良反应的发生率很低。实际上本品可减轻与抑郁相关的失眠和忧虑。大约4%的病人用药期间因本品的α1肾上腺素能受体的拮抗作用而出现立位血压过低，该发生率低于三环类抗抑郁药，但高于选择性5-羟色胺重摄取抑制剂。约2%的病人服药期间出现窦性心博缓慢。

7. 禁忌:

由于对神经系统起主要作用的药物有损害判断和运动技能的潜力，因此服药期间不应驾车或操作机器。妊娠、乳母、儿童、心脑血管疾病患者及近期有心肌梗塞或不稳定性心脏病史者慎用本品。

8. 相互作用:

用药期间也不应饮酒。该药体外已显示可抑制细胞色素P-4503A4同功酶，因此禁与代谢过程中包含有此酶参与的特非那丁和阿司咪唑并用。

阿普唑仑和三唑仑也被3A4同功酶代谢，与本品并用时可使它们的血药浓度及活性明显增强，因此阿普唑仑和三唑仑的初剂量应分别减少50%和75%。

本品慎与单胺氧化酶抑制剂并用，也慎用于中断单胺氧化酶抑制剂治疗14日内，中断本品治疗至少7日以上才可开始单胺氧化酶抑制剂的治疗。

本品亦可减少氟哌啶醇的清除率，增加地高辛的血浓度，因此本品与它们并用时应密切观察。

9. 制剂:

片剂：100mg, 150mg, 200mg, 250mg, 300mg。

相关化学品信息

83898-04-8 1-萘酚-3,8-二磺酸二钠盐 834885-64-2 83988-34-5 83823-49-8 83592-08-9 3-甲基水杨酸 乙酸-6-溴-2-[4-(二乙氨基)苯基]-1-乙基苯并[CD]吲哚鎓盐 苯乙腈-氰基-13C 83601-86-9 83471-69-6 83777-92-8 3,3,4,4,5,5,6,6,7,7,8,8,9,9,10,10,10-十七氟癸基三甲氧基硅烷 83864-78-2 83704-30-7 500

生成时间2016-12-8 11:21:10