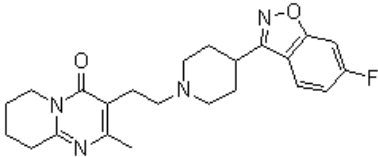


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[106266-06-2](#), 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:106266-06-2 基本信息

中文名:	利培酮; 3-[2-[4-(6-氟-1,2-苯并异噁唑-3-基)-1-哌啶]乙基]-6,7,8,9-四氢-2-甲基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-4-酮
英文名:	Risperidal
别名:	3-(2-(4-(6-Fluoro-1,2-benzisoxazol-3-yl)-1-piperidinyl)ethyl)-6,7,8,9-tetrahydro-2-methyl-4H-pyrido [1,2-a]pyrimidin-4-one; Risperidone
分子结构:	
分子式:	C ₂₃ H ₂₇ FN ₄ O ₂
分子量:	410.49
CAS登录号:	106266-06-2

安全信息

安全说明:	S28: 接触皮肤之后, 立即使用大量皂液洗涤。 S36: 穿戴合适的防护服装。 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)。
危险类别码:	R25: 吞咽有毒。

CAS#106266-06-2化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

萨恩化学技术(上海)有限公司 专业从事106266-06-2及其他化工产品的生产销售 021-58432009

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. 106266-06-2](#) 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:	利培酮 (106266-06-2) 的用途: 该药有5HT ₂ 受体和D ₂ 受体的拮抗作用。用于急性慢性精神分裂症。
	1. 利培酮(106266-06-2)的生产方法: 4-乙酰氯-1-乙酰基哌啶和间二氟苯在三氯化铝催化下, 进行酰化, 再用盐酸水解脱去哌啶环上的乙酰基, 和羟胺反应后再碱催化环合, 得到苯并异噁唑衍生物。 4. 4份该异噁唑衍生物、5. 3份3-氯乙基-2-甲基-4H-吡啶并[1,2-a]嘧啶-4-酮盐酸盐、8份碳酸钠和0.1份碘化钾, 在二甲基甲酰胺中, 于85~90℃加热, 得利培酮(106266-06-2), 收率46%。 2. 产品特性: 1mg该药为白色薄膜衣片, 除去包衣后呈白色; 2mg该药为淡橙色薄膜衣片, 除去包衣片呈白色。 3. 利培酮(106266-06-2)的药理学特征: 本品为苯并异噁唑衍生物, 是新一代的抗精神病药。其活性成份该药是一种具有独特性质的选择性单胺能拮抗剂, 它与5-羟色胺能的5-HT₂受体和多巴胺的D₂受体有很高的亲和力。该药也能与肾上腺素能受体结合, 并且以较低的亲和力与H₁-组胺能受体和α₂-肾上腺素受体结合。该药不与胆碱能受体结合。 该药是强有力的D₂拮抗剂, 可以改善精神分裂症的阳性症状, 但它引起的运动功能抑制, 以及强直性昏厥都要比

生产方法及其他：	经典的抗精神病药少。对中枢系统的5-羟色胺和多巴胺拮抗作用的平衡可以减少发生锥体外系副作用的可能，并将其治疗作用扩展到精神分裂症的阴性症状和情感症状。 4. 利培酮(106266-06-2)的药代学特征： 该药经口服后可被完全吸收，并在1-2小时内达到血药浓度峰值，其吸收不受食物影响。在体内，该药部分代谢成9-羟基-利培酮，后者与该药有相似的药理作用。 本品在体内可迅速分布，该药的血浆蛋白结合率为88%，9-羟基-利培酮的血浆蛋白结合率为77%。该药的消除半衰期为3小时左右，抗精神病有效成份的消除半衰期为24小时。大多数病人在1天内达到该药的稳态，经过4-5天达到9-羟基-利培酮的稳态。 用药一周后，70%的药物经尿液排泄，14%的药物经粪便排泄，经尿排泄的部分中，35-45%为该药和9-羟基-利培酮，其余为非活性代谢物。老年患者和肾功能不全患者的该药血浆浓度较高，清除速度较慢。 5. 作用与用途： 用于治疗急性和慢性精神分裂症以及其它各种精神病性状态的明显的阳性症状(如幻觉、幻想、思维紊乱、敌视、怀疑)和明显的阴性症状(如反应迟钝、情绪淡漠及社交淡漠、少语)。也可减轻与精神分裂症有关的情感症状(如：抑郁、负罪感、焦虑)。对于急性期治疗有效的患者，在维持期治疗中，维思通可继续发挥其临床疗效。 6. 不良反应： (1)与服用本品有关的常见不良反应是：失眠、焦虑、头痛、头晕、口干。 (2)较少见的不良反应有：嗜睡、疲劳、注意力下降、便秘、消化不良、恶心、呕吐、腹痛、视物模糊、阴茎异常勃起、勃起困难、射精无力、性淡漠、尿失禁、鼻炎、皮疹以及其它过敏反应。 (3)可能引起锥体外系症状，如：肌紧张、震颤、僵直、流涎、运动迟缓、静坐不能、急性肌张力障碍。通过降低剂量或给予抗帕金森氏综合征的药物可消除。 (4)偶尔会出现(体位性)低血压、(反射性)心动过速或高血压的症状。 (5)会出现体重增加、水肿和肝酶水平升高的现象。 (6)偶尔会由于病人烦渴或抗利尿激素分泌失调(SIADH)引发水中毒。 (7)会引起血浆中催乳素浓度的增加，其相关症状为：溢乳、男子女性型乳房、月经失调、闭经。 (8)偶见迟发性运动障碍、恶性症状群、体温失调以及癫痫发作。 (9)有轻度中性粒细胞和/或血小板计数下降的个案报导。 7. 禁忌症 已知对本品过敏的患者禁用。 8. 注意事项： (1)患有心血管疾病(如心衰、心肌梗塞、传导异常、脱水、失血及脑血管病变)的人应慎用，从小剂量开始并应逐渐增加剂量(见用法用量)。 (2)由于本品具有α受体阻断活性，因此在用药初期和加药速度过快时会发生(体位性)低血压，此时则应考虑减量。 (3)同其它具有多巴胺受体拮抗剂性质的药物相似，引起迟发性运动障碍，其特征为有节律的不随意运动，主要见于舌及面部。如果出现迟发性运动障碍，应停止服用所有的抗精神病药。 (4)已有报道指出，服用经典的抗精神病药会出现恶性症状群，其特征为高热、肌肉僵直、颤抖、意识改变和肌酸磷酸激酶水平升高。此时应停用包括本品在内的所有抗精神药物。 (5)患有帕金森氏综合征的病人应慎用本品，因为在理论上该药会引起此病的恶化。 (6)经典的抗精神病药会降低癫痫的发作阈值，故患有癫痫的病人仍应慎用本品。 (7)服用本品的患者应避免进食过多，以免发胖。 (8)鉴于本品对中枢神经系统的作用，在与其它作用于中枢的药物同时服用时应慎重。 (9)本品对需要警觉性的活动有影响。因此，在了解到患者对该药的敏感性前，建议患者不应驾驶汽车或操作机器。孕妇及哺乳妇女用药 怀孕妇女服用本品是否安全尚不明确。动物实验表明：该药对生殖无直接的毒性，也无致畸作用。尽管如此，除非益处明显大于可能的危险，怀孕妇女仍不应服用本品。 本品是否会经人体乳汁排出尚不清楚，动物实验表明，该药和9-羟基-利培酮会经动物乳汁排出。因此，服用本品的妇女不应哺乳。 9. 儿童用药： 对于15岁以下儿童目前尚缺乏足够的临床经验。
----------	--

10. 老年患者用药：
建议起始剂量为每日0.5mg或更低，根据个体需要，剂量逐渐加大到每2次，每次1-2mg。在获得更多的经验前，老年人加量过程中应慎重。
11. 药物相互作用：
(1) 本品可拮抗左旋多巴及其它多巴胺促效剂的作用。
(2) 酰胺咪嗪及其它的肝酶诱导剂会降低本品活性成份的血浆浓度，一旦停止使用酰胺咪嗪或其它肝酶诱导剂，则应重新确定使用本品的剂量，必要时可减量。
(3) 酚噻嗪、三环抗抑郁药和一些β-阻断剂会增加本品的血药浓度，但不增加抗精神病活性成份的血药浓度。
(4) 当和其它高度蛋白结合的药物一起服用时，不存在有临床意义的血浆蛋白的相互置换。
12. 贮存：
常温常压下稳定，避免与强氧化剂接触。密封储存，储存于阴凉、干燥的库房。
13. 其他：
①疏水参数计算参考值(XlogP)：2.7；
②氢键供体数量：0；
③氢键受体数量：6；
④可旋转化学键数量：4；
⑤拓扑分子极性表面积(TPSA)：61.9；
⑥重原子数量：30。

相关化学品信息

[碳酸二苯酯](#) [103140-30-3](#) [104628-26-4](#) [100604-29-3](#) [109444-03-3](#) [101594-06-3](#) [103588-73-4](#) [三甲基溴化锡](#) [109581-73-9](#) [101-30-4](#) [100531-21-3](#) [100144-74-9](#) [105020-39-1](#) [102227-52-1](#) [106732-52-9](#) [氯酸钾](#) [七水硫酸锌](#) [三羟甲基氨基甲烷](#)