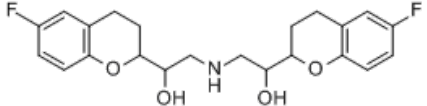




本PDF文件由 www.ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击99200-09-6, 若要查询其它化学品请登录CAS号查询网

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](http://www.ichemistry.cn)

CAS Number:99200-09-6 基本信息

中文名:	奈必洛尔; 双[2-(6-氟苯并二氢吡喃-2-基)-2-羟基乙基]胺
英文名:	Nebivolol
别名:	1-(6-Fluorochroman-2-yl)-2-[[2-(6-fluorochroman-2-yl)-2-hydroxy-ethyl]amino]ethanol
分子结构:	
分子式:	C ₂₂ H ₂₅ F ₂ NO ₄
分子量:	405.44
CAS登录号:	99200-09-6

CAS#99200-09-6化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 专业从事99200-09-6及其他化工产品的生产销售 0712-2580635 15527768836

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. 99200-09-6](http://CAS.No.99200-09-6) 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:	<p>奈必洛尔 (99200-09-6) 的用途:</p> <p>该药是第三代β受体阻滞剂, 有高度β₁受体选择性和轻度血管扩张作用。适用于轻至中度高血压病人的治疗, 亦可用于心绞痛和充血性心力衰竭的治疗。</p>
生产方法及其他:	<p>1. 奈必洛尔 (99200-09-6) 的生产方法:</p> <p>6-氟-3,4-二氢-2-环氧环基-2H-1-<u>苯</u>并吡喃、6-氟-3,4-二氢-α-[[(苯基甲基)氨基]甲基]-2H-1-苯并吡喃-2-<u>甲醇</u>和<u>乙醇</u>一起搅拌回流6h。浓缩至油状物, <u>硅胶</u>柱层析, 用95:5的<u>氯仿</u>-<u>甲醇</u>展开, 得α, α-[[(苯基甲基)亚氨基]双(亚甲基)]双[6-氟-3,4-二氢-2H-1-苯并吡喃-2-<u>甲醇</u>]。将该化合物和甲醇, 在10%钨-炭催化下, 在室温和常压下氢化。滤去催化剂, 滤液浓缩, 剩余物溶于<u>二氯甲烷</u>, 用10%<u>氢氧化钠</u>溶液和<u>水洗</u>, 干燥, 过滤, 浓缩。剩余物真空干燥, 得奈必洛尔 (99200-09-6)。</p> <p>2. 适应症:</p> <p>具有血管扩张活性的选择性β₁肾上腺素受体拮抗剂, 无内源性产感神经活性。用于轻至中度高血压病人的治疗, 亦可用于心绞痛和充血性心力衰竭的治疗。</p> <p>3. 制剂规格:</p> <p>片剂, 5mg/片。</p> <p>4. 用法用量:</p> <p>一日一次, 一次一片, 肝肾功能不全及老年人可适当减量。</p> <p>5. 不良反应:</p> <p>本品不良反应较少, 最常见的有头痛、眩晕、乏力、感觉异常、便秘、腹泻等。这些不良反应通常是一过性的, 很少因此而停药。本品不引起体位性低血压, 很少诱发心衰或引起严重缓慢性心律失常。</p> <p>6. 奈必洛尔 (99200-09-6) 的产品介绍:</p> <p>该药是一种强效、选择性的第三代β受体阻滞剂, 阻滞β₁受体的强度为β₂受体的290倍, 而比索洛尔为26</p>

倍,阿替洛尔为15倍,普奈洛尔为1.9倍。因此本品具有更高的选择性,不会引起支气管平滑肌和血管平滑肌收缩,无内源性拟交感活性。

对心功能和血流动力学的影响:该药无明显负性肌力作用,相反,它对心功能有一定的保护作用,可降低心脏前负荷,而心脏后负荷无变化或略有下降。应用本品后可使心力衰竭患者射血分数增加,而肺动脉压和肺毛细血管压无明显变化。

对运动耐量的影响:许多 β 受体阻滞剂可影响运动耐量,而本品对运动耐量影响较小。本品和阿替洛尔均能增加运动时每搏输出量,但本品增加运动时心输出量,并显著降低总外周血管阻力,而阿替洛尔无此作用。

扩血管作用:本品具有额外的扩血管作用,这是其区别于其他 β 受体阻滞剂的一个显著优点。本品的左旋体和右旋体均有扩血管作用,但左旋体的扩血管作用是血管内皮依赖的,即主要通过加强一氧化氮的作用来发挥其扩血管作用。奈必洛尔无肾上腺素能 α 受体阻滞作用,当使用 α 受体激动剂苯福林后,它仍有扩血管作用。

对代谢影响:本品对代谢无明显不利影响,对高血压患者血糖无明显影响,不引起血清总胆固醇、低密度脂蛋白胆固醇、极低密度脂蛋白胆固醇、高密度脂蛋白胆固醇及载脂蛋白A1和B明显变化。本品对肾脏血流动力学无明显影响。

本品可长期使用,在连续用3年仍能维持降压疗效,不会因药物耐受性而引起疗效降低。

7. 奈必洛尔(99200-09-6)的临床评价:

509例高血压病人参与的为期4周的多中心双盲随机安慰剂对照平行分组剂量研究显示,0.5~10毫克降低收缩压和舒张压的作用与剂量呈相关性。1天1次2.5毫克以上剂量可达到明显的降压效果。1天1次5毫克的降压疗效明显优于2.5毫克或安慰剂。1天1次10毫克的降压疗效并不优于5毫克。

在114例原发性高血压病人的多中心双盲安慰剂对照试验研究中发现,本品天5毫克,连用8周,可降低仰卧位和立位血压,并减慢心率舒张压降至正常或降低10%以上者达65%。

在轻至中度高血压病人中进行的多项多中心随机双盲对照研究表明,本品1天5毫克或10毫克降压疗效相当于阿替洛尔50毫克,美托洛尔100毫克,硝苯地平缓释制剂20毫克,1天两次或赖诺普利1天10毫克;明显优于依那普利1天10毫克,氢氯噻嗪1天25毫克及安慰剂的疗效。

在30例非胰岛素依赖型糖尿病高血压病人参与的随机双盲平行分组对照研究中,本品1天5毫克,连用6个月的降压效果与阿替洛尔相似,且不影响胰岛素的敏感性。

10例轻至中度高血压和肾动脉硬化病人接受本品1天5毫克,连用4周。结果,病人的舒张压和血浆肾素明显下降,肾功能无明显改变。

在16例稳定型心绞痛病人中进行的随机双盲安慰剂对照交叉研究中,给予本品5毫克,1天1次,连用两周,具有抗心绞痛和抗心肌缺血作用。本品能明显减慢休息和运动时的心率,降低血压,还可改善左心室的扩张性,降低心脏前后负荷,从而具有保护左心室功能的作用。

多项研究表明,本品5毫克,1天1次,可改善稳定型充血性心力衰竭病人的心脏功能。

本品作为第三代 β 受体拮抗剂与其它 β 受体拮抗剂不同,它将高度选择性的 β 受体拮抗剂与一氧化氮介导的血管扩张作用相结合,对内皮功能有利的作用。能为高血压和心力衰竭患者良好耐受。在欧洲该产品获准用于治疗原发性高血压,还与标准治疗配合用于70岁以上病人的轻到中度慢性心力衰竭(CHF),能有效地降低老年CHF病人的死亡率和心血管住院组合评价终点。本产品凭借其其对心脏的保护作用、良好的降压作用、良好耐受性及不良反应少等优点,必将在抗高血压药物市场中抢占较大的份额,给企业带来巨大的社会效益和经济效益。本产品市场前景广阔,潜力巨大。

相关化学品信息

[\(S\)-4-苯基-2-噁唑烷酮](#) [2-氯-4-硝基-6-溴苯胺](#) [99566-46-8](#) [99948-85-3](#) [烯草酮](#) [99168-12-4](#) [云实素J](#) [994-36-](#)
[5](#) [99163-25-4](#) [N-甲基-D-脯氨酸](#) [99840-60-5](#) [2-氨基-4-硝基甲苯](#) [对硝基苯甲酸乙酯](#) [DEFENSIN HNP-1 \(HUMAN\)](#) [99257-](#)
[43-9](#) 429

生成时间2021/1/17 21:01:17