



本PDF文件由

爱化学
iChemistry.cn免费提供，全部信息请点击[84057-84-1](#)，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:84057-84-1 基本信息

中文名:	拉莫三嗪; 6-(2,3-二氯苯基)-1,2,4-三嗪-3,5-二胺
英文名:	Lamotrigine
别名:	6-(2,3-Dichlorophenyl)-1,2,4-triazine-3,5-diamine
分子结构:	
分子式:	C9H7Cl2N5
分子量:	256.09
CAS登录号:	84057-84-1
EINECS登录号:	281-901-8

物理化学性质

熔点:	177-181°C
-----	-----------

安全信息

安全说明:	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。 R36/37/38: 对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。

CAS#84057-84-1化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

湖北三元素生物科技有限公司 专业从事84057-84-1及其他化工产品的生产销售 027-50669369

孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 拉莫三嗪专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0712-2580635 15527768836

将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 长期供应6-(2,3-二氯苯基)-1,2,4-三嗪-3,5-二胺等化学试剂, 欢迎垂询报价 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. 84057-84-1](#) 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:	拉莫三嗪(84057-84-1)的用途: 该药是新型抗癫痫药, 其作用类似 苯妥英钠 和卡马西平, 对强电刺激或戊四氮引起的小鼠后肢强直有明显的抑制作用。用于抗癫痫。
生产方法及其他:	1. 拉莫三嗪(84057-84-1)的生产方法: 2, 3-二氯苯甲酸氯化为2, 3-二氯苯甲酰氯, 再和氰化亚铜反应后, 和氨基脲缩合, 最后在氢氧化钾作用下环合得拉莫三嗪(84057-84-1)。 2. 功用作用: 本品为苯基三嗪类化合物, 是一种新型的抗癫痫药。实验证明, 本品可抑制成四氯和电刺激所致的惊厥,

缩短病灶、皮层和海马区兴奋后的放电时间，对抗部分和全身性癫痫发作，其作用机制可能是通过抑制脑内兴奋性氨基酸-谷氨酸、天门冬氨酸的释放，产生抗癫痫作用。

本品口服吸收完全，生物利用度为100%。服药2.5小时达血药峰浓度，主要经肝脏代谢，经肾脏排泄。平均血浆 $t_{1/2}$ 为29小时。主要用于其它抗癫痫药不能控制的部分性和全身性癫痫发作的辅助治疗。

3. 药理作用：

本品为电压敏感性钠通道阻滞剂，通过减少钠通道的钠内流而增加神经元的稳定性。在体外培养神经元中，可抑制兴奋性神经递质谷氨酸诱发的爆发性放电；阻滞癫痫病灶快速放电和神经元去极化，但不影响正常神经兴奋传导。

药理学研究的结果提示该药是一种电压性的钠离子通道阻滞剂。在培养的神经细胞中，它反复放电和抑制病理性释放谷氨酸(这种氨基酸对癫痫发作的形成起着关键性的作用)，也抑制谷氨酸诱发的动作电位的爆发。在为评价药物对中枢神经系统作用而设计的试验中，健康志愿者服用该药240mg，所得结果与安慰剂无异；然而1000mg苯妥英和10mg安定都显著地损害细微的视觉运动的协调和眼球运动，增加和产生主观的镇静作用。另一项研究中，单剂口服600mg的卡马西平明显地损害了细微视觉运动的协调和眼球运动，此时身体的摆动和心率均增加；然而，使用150mg和300mg剂量的该药，结果与安慰剂无差异。

4. 用法用量：

(1)单独使用：初始剂量25mg，每日一次。两周后可增至50mg，一日一次，两周后可酌情增加剂量，最大增加量为50~100mg，此后，每隔1~2周可增加剂量一次，直至达到最佳疗效，一般须经6~8周。通常有效维持量为100~200mg/d，一次或分两次服用。

(2)与丙戊酸合用：成人和12岁以上儿童，初始剂量25mg，隔日一次，第3、4周开始改为25mg，一日二次。此后每1~2周可增加25~50mg，直至达到维持剂量为100~150mg/d。与具酶诱导作用的抗癫痫药合用：初始剂量50mg，每日一次，服药两周后可增至100mg/d，分两次服，两周后酌情增加剂量，最大增加量为100mg，此后每隔1~2周可增加剂量一次，直至达到最佳疗效。通常最佳维持量为200~2100mg/d，分两次服用。

(3)2~12岁儿童：与丙戊酸合用：初始剂量为0.2mg/(kg?d)，每日一次，两周后增至0.5mg/(kg?d)，每日一次，再两周后酌情增加剂量，最大增加量为0.5~1mg/kg，此后每隔1~2周可增加剂量一次，直至达到最佳疗效，通常维持量为1~2mg/(kg?d)，一次或分两次服。与具酶诱导作用的抗癫痫药合用：初始剂量为2mg/(kg?d)，分两次服，两周后增至5mg/(kg?d)，分两次服。再两周后酌情增加剂量，最大增加量为2~3mg/kg。此后每隔1~2周可增加剂量一次，直至达到最佳疗效。通常有效维持量为10mg/(kg?d)，分两次服，最大剂量为400mg/d。

5. 注意事项：

(1)常见副作用有恶心、头痛、视物模糊、眩晕、共济失调等。偶见皮疹，反应不严重时可不撤药。罕见血管神经性水肿和Stevens Johnson综合征。

(2)妊娠早期妇女不宜用。

(3)儿童不宜长期服用。

(4)对该药过敏的患者禁用。在用本药治疗的前8周，如果儿童出现皮疹和发热症状，应该考虑有药物反应的可能性。发生皮疹总的危险性与下列因素有关：该药的初始剂量太高和随后增加的剂量超过推荐剂量、同时应用丙戊酸钠。出现皮疹的所有病人(成人和儿童)都应迅速被评估，并立即停用该药，除非可确诊皮疹与此药无关。

6. 药动学：

本品口服吸收快而完全，不受食物影响，生物利用度为98%。达峰时间约为0.5~5.0小时，平均2~3小时，血浆蛋白结合率约55%，表观分布容积为0.9~1.3/kg，半衰期为6.4~30.4小时(平均12.6小时)。与其他抗癫痫药合用时，将改变本品代谢，如与酶诱导剂卡马西平、苯妥英合用时，平均半衰期缩短约一半；与酶抑制剂丙戊酸合用，平均半衰期约增加一倍，为11.2~51.6小时(平均27小时)。本品在肝脏代谢，其消除主要以葡萄糖醛酸结合的形式由肾脏排出，尿中排出的原形药少于10%，2%通过粪便排泄。代谢产物无生物活性。

7. 适应症：

本品用于成人和12岁以上儿童复杂部分性发作或全身强直阵挛性癫痫发作的辅助治疗。作为辅助治疗用于难治性癫痫时，可用于2岁以上儿童及成人。

8. 不良反应：

常见的不良反应包括：头痛、头晕、嗜睡、视物模糊、复视、共济失调、皮疹、便秘、恶心、呕吐；较少见的不良反应有变态反应、面部皮肤水肿、肢体坏死、腹胀、光敏性皮炎、食欲不振、体重减轻和自杀企图等；罕

见出现严重的有致命危险的皮肤不良反应(如Steven-Johnson综合征)、Lyell综合征、弥漫性血管内凝血、多器官衰竭。

9. 相互作用:

- (1) 禁用于对本品过敏者。
- (2) 慎用于孕妇、哺乳期妇女, 服药期间避免驾车及从事机械操作。
- (3) 不宜突然停药, 因可能引起癫痫反弹发作, 应在两周内逐渐减少剂量, 但服药时如出现皮疹等过敏反应, 应立即停药。
- (4) 一般不影响其他抗癫痫药的药动学特点, 但合用时最好监测这些药物的血药浓度。

10. 疗效评价:

当与其他抗癫痫药同用时, 突然停用本药可引起癫痫反弹发作。除非出于安全性的考虑(例如皮疹)要求突然停药, 否则本药的剂量应该在2周内逐渐减少至停药。当欲停止使用其他合用的抗癫痫药物以便达到本药单药治疗, 或在本药单药治疗中添加其他抗癫痫药物时, 都应考虑对该药药动学的影响。

相关化学品信息

84434-39-9	84445-77-2	84859-22-3	84029-89-0	845-30-7	84100-24-3	845781-09-1	枯茗(CUMINUM CYMINUM)籽提取物	2-氯-4-氟-5-硝基苯甲醚	847-51-8	84027-96-3	84145-56-2	84522-32-7	84522-16-7	84531-36-2	447
----------------------------	----------------------------	----------------------------	----------------------------	--------------------------	----------------------------	-----------------------------	---	---------------------------------	--------------------------	----------------------------	----------------------------	----------------------------	----------------------------	----------------------------	-----

生成时间2021/3/27 0:46:43