

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:82410-32-0 基本信息

中文名:	更昔洛韦; 9-(1,3-二羟基-2-丙氧甲基)鸟嘌呤
英文名:	Ganciclovir
别名:	2-Amino-1,9-dihydro-9-((2-hydroxy-1-(hydroxymethyl)ethoxy)methyl)-6H-purin-6-one; 9-((2-Hydroxy-1-(hydroxymethyl)ethoxy)methyl)guanine; 9-(1,3-Dihydroxy-2-propoxymethyl)guanine; 2'-NDG; 2'-Nor-2'-deo
分子结构:	
分子式:	C ₉ H ₁₃ N ₅ O ₄
分子量:	255.23
CAS登录号:	82410-32-0

物理化学性质

熔点:	250°C
性质描述:	更昔洛韦(82410-32-0)的性状: 从甲醇结晶,熔点250°C(分解);也有报道从水中得到一水合物,熔点248~249°C(分解);从水中结晶,熔点>300°C。UV最大吸收(甲醇):254nm(ε12880)。在水中25°C的溶解度:pH=7时为4.3mg/mL。急性毒性LD ₅₀ 小鼠(g/kg):1~2腹腔注射。

安全信息

安全说明:	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)。 S53: 避免暴露——使用前先阅读专门的说明。 S36/37/39: 穿戴合适的防护服、手套并使用防护眼镜或者面罩。
危险品标:	
	T: 有毒物质
危险类别码:	R46: 可能引起遗传基因损害。 R60: 可能降低生殖能力。 R61: 可能对未出生的婴儿导致伤害。

CAS#82410-32-0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. 82410-32-0](#) 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: 抗病毒药。

更昔洛韦 (82410-32-0) 的制备方法:

将1, 3-二苄氧基-2-氯甲氧基丙烷悬浮于HMDS (1, 1, 1, 3, 3, 3-hexamethyldisilizane) 中, 加入硫酸铵, 回流2h。反应液减压浓缩, 往剩余的黄色固体加入氧化汞和苯, 加热至回流。加入6-氯鸟嘌呤的苯溶液, 在氮气气下回流3h。减压蒸出苯, 剩余物和二氯甲烷搅拌后过滤。滤液用30%碘化钾水溶液洗2次, 10%碳酸钾洗2次, 水洗2次, 饱和氯化钠洗, 干燥。减压浓缩, 得烷基化产物。将该产物溶于甲醇, 加入甲醇钠的甲醇溶液, 再加入2-巯基乙醇和水, 在氮气下回流1h。反应液减压浓缩, 倾入水中, 用冰乙酸调pH至6。过滤收集析出的沉淀, 用水彻底洗涤, 再用乙醚洗, 真空干燥, 然后和热乙酸乙酯一起搅拌, 过滤收集固体, 用无水乙醇重结晶, 得羟基化产物。将该羟基化产物溶于回流中的乙醇, 加入环己烯和铂黑, 回流18h。过滤除去催化剂, 并用100℃的二甲基甲酰胺洗5次。洗液和滤液合并后浓缩, 剩余物溶于热的50%乙醇水溶液, 用活性炭过滤。滤液减压浓缩, 剩余物用乙醇-水 (4: 1) 结晶, 得更昔洛韦。

制剂规格:

每小瓶含有540 mg冻干、白色或接近于无色的钠盐粉末, 相当于丙氧鸟苷500 mg。用10 mL注射用水可配制成浓度为50 mg/mL的溶液, pH值为11。

更昔洛韦 (82410-32-0) 的药理毒理:

细胞内的丙氧鸟苷经脱氧鸟苷激酶作用被磷酸化为丙氧鸟苷的一价磷酸盐, 也可被一些细胞激酶进一步磷酸化为三价磷酸盐, 在被巨细胞病毒感染的细胞内丙氧鸟苷可被优先磷酸化。丙氧鸟苷三价磷酸盐的代谢非常缓慢, 从细胞外液分离后18h尚可保存 60~70%。其抑制病毒DNA合成的机制在于1. 竞争抑制脱氧鸟苷的三价磷酸盐与DNA聚合酶的结合, 2. 丙氧鸟苷的三价硝酸盐与病毒DNA的结合最终导致DNA延长的停止。从接受本药治疗的巨细胞病毒感染患者中发现, 巨细胞病毒可以产生急性抗药性。丙氧鸟苷是化学合成的鸟嘌呤类似物, 能够阻止疱疹病毒的复制。对其敏感的病毒包括CMV, HSV-1, HSV-2, EBV, VZV。临床研究仅限于对巨细胞病毒感染患者疗效的评价。

药动学:

本药主要是通过肾小球滤过作用以原型排出。肾功能正常的患者, 以5 mg/kg体重的剂量持续注射1 hr后, 其半衰期为2.9 hr, 平均清除率为3.64 mL/分/kg体重。以5 mg/kg体重的剂量, 每日注射2次, 14天后未引起药物积蓄。肾功能不全的患者, 血肌酐含量分别为<124 μmol/L、125~225 μmol/L及226~398 μmol/L时, 药物血浆清除率和半衰期分别为3.64 mL/分/kg体重和2.9 hr, 2.01 mL/分/kg体重和5.3 hr及1.11 mL/分/kg体重和9.7 hr。严重肾功能受损的患者, 血液透析可使药物浓度降低50%。

适应证:

预防及治疗免疫功能缺陷病人的巨细胞病毒感染, 如艾滋病患者, 接受化疗的肿瘤患者, 使用免疫抑制剂的器官移植病人。

更昔洛韦 (82410-32-0) 的不良反应:

白细胞及血小板减少最常见, 少见的有贫血, 发热, 皮疹, 肝功能异常, 浮肿, 感染, 乏力。心律失常, 高/低血压。思维异常或恶梦, 共济失调, 昏迷, 头昏, 头痛, 紧张, 感觉障碍, 精神病, 嗜睡, 震颤。恶心, 呕吐, 腹泻, 胃肠道出血, 腹痛。嗜曙红细胞增多, 低血糖。呼吸困难。脱发, 瘙痒, 莖麻疹。血尿及尿素氮升高。有巨细胞病毒感染性视网膜炎的艾滋病患者可出现视网膜剥离。注射处可见感染, 疼痛, 静脉炎。

相互作用:

丙磺舒以及其它一些可以抑制肾小管分泌和重吸收的药物, 能降低肾脏对本药的清除率及延长其半衰期。本药与抑制细胞快速分裂复制的药物同时使用可产生协同效应。本药与氨基甙, 戊烷脒, 氟胞嘧啶, 长春新碱, 长春花碱, 阿霉素, 两性霉素, 三甲氧基氨基嘧啶以及一些核苷类药物联合使用, 可增加副作用的发生。艾滋病患者同时使用本药和齐多夫定, 大多会产生严重的白细胞降低。本药与伊米配能/西司他丁钠盐联合使用可诱发癫痫。

更昔洛韦 (82410-32-0) 的用法用量:

巨细胞病毒感染的治疗 预防和诱导期: 5 mg/kg体重/次, 每日2次静脉注射, 每次注射时间应超过1 hr, 维持14~21天。维持期: 6 mg/kg体重/日, 每周5天或5 mg/kg体重/日, 每周7天, 静脉注射。当患者的视网膜炎有进一步发展时, 需要再次使用诱导剂量进行治疗。

巨细胞病毒感染疾病的预防 诱导量5 mg/kg体重, 每12 h注射1次, 维持7~14天。

当患者肾功能不全时, 诱导剂量应调整如下: 血肌酐<124 μmol/L者, 剂量不变; 血肌酐为125~225 μmol/L时, 使用2.5 mg/Kg体重, 每日2次的剂量; 血肌酐为226~398 μmol/L时, 剂量为2.5 mg/kg体重, 每日1次; 血肌酐>398 μmol/L时, 剂量为1.25 mg/kg体重, 每日1次。其最佳维持剂量尚不明确, 透析患者的用药剂量为1.25 mg/kg体重/日。一天的透析结束后应立即用药。症状 500 mg/kg对动物一次性静脉注射可产生呕吐、唾液分泌过多、出血、迟钝、肝功能异常、尿素氮升高、睾丸萎缩、死亡。治疗 血液透析及增加补液可降低药物血浆浓度。每

小瓶应加入10 mL注射用水，其配制溶液浓度为50 mg/mL，将药物加入100 mL静脉注射液中，注射时间应超过1h。0.9%生理盐水，5%葡萄糖，乳酸钠注射液及林格氏液可以与本药配伍，含有对羟基甲酸盐成分的抗生素溶液与本药不相容。稀释后的注射用液应当冷藏但不能冷冻，而且必需在24 hr内使用。

更昔洛韦（82410-32-0）的注意事项：

怀孕及哺乳期妇女，对本药或阿昔洛韦过敏者禁用。致癌、致畸性及对生育能力影响 临床前期研究发现，本药可以引起精子减少，突变，致畸及致癌，在停止治疗的90天内应采取避孕措施。大约10~40%接受治疗的患者出现白细胞减少，因此本药应慎用于有白细胞减少病史的患者。10%接受本药治疗的患者出现血小板减少(少于5万个/L)，接受免疫抑制药物治疗的患者比艾滋病患者下降得更低。当患者的血小板计数少于10万个/L时，发生血小板减少的风险也增大。

对妊娠和哺乳的影响 动物实验发现本药有致畸作用，怀孕期妇女不能使用。本药对哺乳动物的后代可产生不良影响。目前尚不知本药是否能分泌到人乳中，故不能在哺乳妇女中使用，使用本药72 h后才能恢复哺乳。

对儿童的影响 应用于12岁以下儿童的临床经验有限，故儿童应慎用。据报道其不良后果与成人相似。

对老年人的影响 应按肾功能情况调整用药剂量。

其它：

1、疏水参数计算参考值 (XlogP) : -1.7

2、氢键供体数量：4

3、氢键受体数量：7

4、可旋转化学键数量：5

5、互变异构体数量：6

6、拓扑分子极性表面积 (TPSA) : 135

按规定使用和贮存的不会分解，避氧化物。2~8℃冷藏、密闭、干燥处。

相关化学品信息

[2-\(2-戊烯基\)呋喃 82118-18-1](#) [4-溴苯酐 82863-40-9](#) [2-氨基-3-氟苯甲酸 828-01-3](#) [2-氨基-5,6-二氯-4H-环戊并噻唑盐酸盐 7-溴-2-\(1H\)-噻唑啉酮](#) [1,4-苯二羧酸二甲酯与1,3-二羟基-1,3-二氧-5-异苯并呋喃羧酸、1,2-乙二醇、4,4'-亚甲基二\(苯胺\)、1,2-丙二醇和1,3,5-三\(2-羟乙基\)-1,3,5-三嗪-2,4,6\(1H,](#) [82228-89-5](#) [82762-60-5](#) [2,4-二溴丁酰氯 82452-93-5](#) [2-\(2-硝基乙基\)-\[1,3\]二氧戊烷 2-甲氧基对苯二酚 硝酸锶 二甲基甲酰胺 异丁醛 599](#)