



本PDF文件由

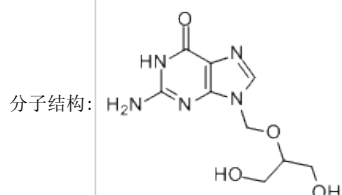
免费提供, 全部信息请点击[82410-32-0](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](#)

CAS Number: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



分子式: $C_9H_{13}N_5O_4$

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 (ϵ 12880)。在水中25°C的溶解度: pH=7时为4.3mg/mL。急性毒性LD₅₀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: 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-hexamethyldisilazane）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氰化[汞](#)和[苯](#)，加热至回流。加入6-氯鸟嘌呤的苯溶液，在氮气氛下回流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[磷酸](#)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，荨麻疹。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。本药与氨苯砜，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。

巨细胞病毒感染性疾病的预防 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125-225μmol/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、迟纯、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

生产方法及其他：

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**甲磺**盐成分的抗菌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-溴苯酚](#) [82863-40-9](#) [2-氨基-3-氟苯甲酸](#) [828-01-3](#) [2-氨基-5,6-二氢-4H-环戊并噻唑盐酸盐](#) [7-溴-2-\(1H\)-喹啉酮](#) [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](#) [硝酸铯](#) [二甲基甲酰胺](#) [异丁醛](#) 599