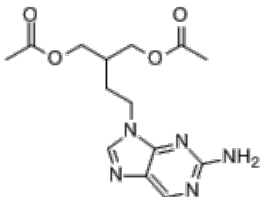




本PDF文件由 免费提供, 全部信息请点击[104227-87-4](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

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:104227-87-4 基本信息

| | |
|---------|---|
| 中文名: | 泛昔洛韦; 2-[2-(2-氨基-9H-嘌呤-9-基)乙基]-1,3-丙二醇-二乙酯 |
| 英文名: | Famciclovir |
| 别名: | [2-(acetyloxymethyl)-4-(2-aminopurin-9-yl)-butyl] acetate |
| 分子结构: |  |
| 分子式: | C ₁₄ H ₁₉ N ₅ O ₄ |
| 分子量: | 321.33 |
| CAS登录号: | 104227-87-4 |

物理化学性质

| | |
|-------|--|
| 性质描述: | <p>泛昔洛韦(104227-87-4)的性状:</p> <ol style="list-style-type: none"> 1. 从乙酸乙酯-己烷得白色有光泽的片状结晶, 熔点102~104℃。 2. UV最大吸收(甲醇): 222nm, 244nm, 309nm(ε27500, 4890, 7160)。水中溶解度(25℃): 初时>25%(体积); 很快形成单水合物沉淀(2%~3%体积)。易溶于丙酮或甲醇, 难溶于乙醇或异丙醇。 |
|-------|--|

CAS#104227-87-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

 Sigma-Aldrich 专业从事104227-87-4及其他化工产品的生产销售 800-736-3690
 大连美仑生物技术有限公司 泛昔洛韦专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0411-82593631、82593920
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. 104227-87-4 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: | 抗感染药。 |
| | <p>泛昔洛韦(104227-87-4)的制备方法:</p> <p>1. 制备方法一:</p> <p>0.5mol 2-氨基-6-氯嘌呤溶于含50g氢氧化钠的500mL水中, 在10g钯-碳存在下, 于0.7MPa氢压和50℃氢化3h, 得到83%收率的2-氨基嘌呤。2-氨基嘌呤、2-(2-碘乙基)丙二醇二乙酯和碳酸钾在二甲基甲酰胺中, 在室温下搅拌18h, 得58%收率的泛昔洛韦。</p> <p>2. 制备方法二:</p> <p>22.5g鸟嘌呤、88g三乙基甲基氯化铵和氯化亚砷, 在50~70℃下缓慢搅拌0.5h, 再于70℃下保持0.5h; 得到28.5g 8-氯鸟嘌呤, 其中含14.1%的水。将8-氯鸟嘌呤转化为盐酸盐, 并在五氯化二磷存在下干燥。往该盐酸盐(2.04g)中加入6.6g三乙基甲基氯化铵在11mL乙腈的溶液, 加入5.6mL三氯氧磷, 在60℃下加热1h, 得到1.78g 2-氨基-6, 8-二氯嘌呤。5.8g 2-氨基-6, 8-二氯嘌呤、9.4g 2-(2-碘乙基)丙二醇二乙酸酯和5.9g碳酸钾在100mL二甲基甲酰胺中, 在室温下搅拌过夜, 得到4.7g化合物(II)。3.9g化合物(II)在5%钯-炭存在下, 以0.35MPa的氢压氢化还原, 得到2.4g泛昔洛韦。</p> <p>泛昔洛韦(104227-87-4)的药动学:</p> |

生产方法及其他:

本品口服迅速吸收,生物利用度77%,在体内很快转变为喷昔洛韦,T_{1/2}约为2h,约60-65%经肾排出。在水痘-带状疱疹病毒感染的细胞内有一个较长的半衰期(9-10小时),单纯疱疹病毒1型和2型感染的细胞内半衰期分别为10小时和20小时。

泛昔洛韦(104227-87-4)的作用机理:

进入人体内后迅速转变成喷昔洛韦,喷昔洛韦可被病毒编码的胸苷激酶磷酸化成OCV单磷酸,再经宿主的磷酸化成为喷昔洛韦三磷酸盐,三磷酸盐在病毒感染的细胞内迅速形成,缓慢代谢,致半衰期延长,参与HBV DNA-p的三磷酸鸟苷(Pgtp)竞争,并进入DNA,作用于DNA合成的起始和延伸步骤,抑制DNA的合成,对水痘-带状疱疹病毒、单纯疱疹病毒1型和2型和HBV均有较强的抑制作用。

对乙型肝炎治疗的研究:以双盲随机研究结果表明,口服FCV使血清HBV-DNA下降达90%,但停药后又可上升。目前报告以预防和治疗肝移植的HBV感染,可使病人较不用泛昔洛韦者明显减少HBV感染,延长病人生存期。治疗剂量为:125-500mg/日。Trepo等[149]用分别用125 mg, 250 mg, 500 mg tid或安慰剂治疗16周,随访8个月。再进行16周的开放标记治疗。结果:显示泛昔洛韦对HBV的抑制作用随着剂量的增加而增强,三组疗效比较,500 mg tid组的效果最佳,推荐作为常规治疗的剂量。

Tsiquaye 等[150]已经证实口服泛昔洛韦在鸭胚肝组织和非肝组织细胞中抗鸭HBV复制的作用。同年Boker 等首次用用前列腺素E加泛昔洛韦联合治疗1例肝移植后的重型乙型肝炎患者获得成功。治疗后患者肝功能恢复,病毒复制受到抑制,HBV DNA和HBeAg均转为阴性,仅有HBsAg阳性,肝脏组织学炎症改变好转,患者恢复了正常的工作。Main等[151]首次采用双盲安慰剂对照研究用泛昔洛韦治疗了11例慢性乙型肝炎患者。在口服泛昔洛韦10天后有6例患者的HBV DNA降低90%以上。Haller等[152]报道了他在1993年-1995年期间采用口服泛昔洛韦治疗了18例肝移植后再感染的乙型肝炎患者。前15例患者在临床出现明显的肝炎表现后开始治疗,而后3例在检测到HBV DNA后就立即开始治疗。所有的患者对泛昔洛韦均有较好的耐受性。结果有8例患者HBV DNA阴转,7例患者临床症状改善,5例无变化,6例患者病情恶化死亡。开始治疗较早的患者疗效优于开始治疗晚的患者。Kruger 等[153]对泛昔洛韦治疗肝移植后的复发性乙型肝炎的疗效进行了初步的观察。有12例患者接受了至少3个月泛昔洛韦500mg tid的治疗(其中1例患者在开始治疗的2周内剂量为750mg tid)。有9例患者(75%)在治疗不久血清HBV DNA水平即下降,3个月后HBV DNA水平平均比基线下降80%,6个月下降90%,治疗12个月下降>95%。继续治疗,有5例患者的斑点杂交法HBV DNA阴转,其中1例患者PCR法HBV DNA阴性。3例患者因无效而停药。12例患者中有6例比治疗前ALT平均降低80%,4例患者ALT恢复正常。有1例患者在治疗的第13周因腹膜炎死亡,死亡原因与泛昔洛韦无关。所有患者对泛昔洛韦均有较好的耐受性,在治疗期间未发生明显不良反应。移植肝因复发性乙型肝炎而行肝脏再移植术是很少取得成功的,几乎所有的患者都会发生移植肝的再感染,而且第二次移植肝比第一次移植肝更迅速发生肝衰竭。McCaughan等[154]报道20例两次肝移植患者仅1例存活6个月以上。存活的原因是该例患者在肝移植后使用了更昔洛韦/泛昔洛韦治疗,HBV DNA阴转。泛昔洛韦治疗已达26个月,再次肝移植3年后,患者仍正常。作者认为,肝移植后长期使用核苷类抗病毒药物可改善肝移植患者的预后。

泛昔洛韦(104227-87-4)与其他抗病毒药物联合应用治疗HBV感染的也有报道。Kruger[155]报道用泛昔洛韦和α-2b干扰素联合治疗了1例患乙型肝炎相关性结节性多动脉炎的56岁男性患者,获得成功。Piqueras等[156]报道用泛昔洛韦+干扰素成功治疗1例慢性乙型肝炎患者的肝衰竭。Marques等[157]用泛昔洛韦加α干扰素对5例以前用干扰素治疗失败的成人慢性HBV感染者治疗了20周。治疗方法是:先用泛昔洛韦治疗4周,再加用α干扰素治疗12周,最后停用干扰素,继续使用泛昔洛韦治疗4周。结果有2例患者的HBV DNA阴转,肝功能和肝脏组织学改善。侯金林等[120]在拉米夫定和拉米夫定+泛昔洛韦治疗期间HBV动态改变的研究中也同样证实,联合治疗可提高拉米夫定的抗病毒疗效。

尽管对泛昔洛韦的研究早于拉米夫定,但近年来用其治疗乙型肝炎的报道远远低于拉米夫定。其原因主要是因其抗HBV作用低于拉米夫定,且同样可诱导HBV多聚酶的YMDD耐药性变异,而治疗费用高于拉米夫定。

Seehofer等[72]对1988年-1998年间的179例肝移植后复发性HBV感染的治疗进行了回顾性的分析,比较了使用泛昔洛韦或拉米夫定+乙型肝炎免疫球蛋白治疗肝移植后复发性HBV感染的疗效,发现泛昔洛韦的疗效低于拉米夫定,且使用泛昔洛韦治疗后出现耐药的患者使用拉米夫定治疗仍然有效。Rayes等[10]对肝移植后长期应用泛昔洛韦和拉米夫定(20例)治疗乙型肝炎进行了比较性研究。32例患者使用泛昔洛韦治疗,20例患者使用拉米夫定治疗,7例患者在泛昔洛韦治疗失败后再用拉米夫定治疗。结果19例用泛昔洛韦治疗的患者和76%用拉米夫定治疗的患者HBV DNA阴转;用拉米夫定治疗的患者中有24%的患者HBsAg阴转,而用泛昔洛韦治疗的患者中无1例HBsAg阴转。对泛昔洛韦治疗失败的患者,拉米夫定治疗也是有效的。作者认为,拉米夫定的抗病毒效应比泛昔洛韦强。

最近,Berenguer等[158]报道了6例肝移植后的HBV感染者(HBsAg阳性,HBV DNA阳性,其中4例HBeAg阳性)用泛昔洛韦500mg tid治疗了至少12个月。结果无1例患者完全有效。有3例患者的ALT接近正常,无1例患者出现抗-HBs或

抗-HBe的血清转换。2例患者的HBV DNA阴转，1例下降，其余3例甚至比治疗前DNA水平升高。仅1例患者治疗后肝脏组织学改善。因此作者认为，单独应用泛昔洛韦治疗肝移植后的HBV感染疗效欠佳。

泛昔洛韦(104227-87-4)在泛昔洛韦的III期临床实验中，证实泛昔洛韦是一种强有力的抗HBV药物，但同时也发现长期应用后同样可以导致HBV多聚酶的YMDD基序变异。动物试验结果还证实，HBV对拉米夫定与泛昔洛韦有交叉耐药性。Mutimer[43]证实，在对拉米夫定耐药的两种变异株中，M550V-L526M与泛昔洛韦有交叉耐药性，而M550I与泛昔洛韦无关。据Rayes等[10]报道，长期治疗的患者中拉米夫定的耐药率为55%，而泛昔洛韦为80%。

相关化学品信息

[101831-76-9](#) [10202-94-5](#) [102561-41-1](#) [102375-33-7](#) [L-2-氯苯丙氨酸](#) [104086-19-3](#) [100045-30-5](#) [2,4-二甲基-3-硝基吡啶](#) [10022-74-9](#) [102996-76-9](#) [102479-77-6](#) [102071-47-6](#) [106867-29-2](#) [101453-46-7](#) [100929-86-0](#) 460

生成时间2014-8-18 23:17:20