

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.chemistry.cn](#)

## CAS Number:154361-50-9 基本信息

卡培他滨；

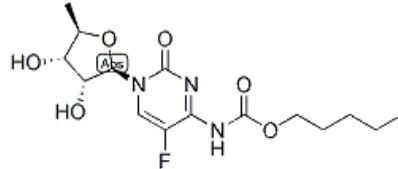
中文名：5-脱氧-5-氟-N-[(戊氧基)羰基]-胞嘧啶核苷；

5-脱氧-5-氟-N-[(戊氧基)羰基]-胞嘧啶核甙

英文名：Capecitabine

别名：Pentyl [1-(3,4-dihydroxy-5-methyl-oxolan-2-yl)-5-fluoro-2-oxo-pyrimidin-4-yl]aminoformate;  
Xeloda

分子结构：

分子式： $C_{15}H_{22}FN_3O_6$ 

分子量：359.35

CAS登录号：154361-50-9

## 物理化学性质

性质描述：卡培他滨(154361-50-9)的性状：  
本品为无色结晶。熔点110~121℃。

## CAS#154361-50-9化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

阿达玛斯试剂 专业从事154361-50-9及其他化工产品的生产销售 400-111-6333

济南久创化学有限责任公司 卡培他滨专业生产商、供应商，技术力量雄厚 0531-82373405

苏州汉德森医药科技有限公司 长期供应5-脱氧-5-氟-N-[(戊氧基)羰基]-胞嘧啶核苷等化学试剂，欢迎垂询报价 0512-69363185

北京海步国际医药科技发展有限公司 生产销售5-脱氧-5-氟-N-[(戊氧基)羰基]-胞嘧啶核甙等化学产品，欢迎订购 010-67886402

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. 154361-50-9](#) 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：卡培他滨(154361-50-9)的用途：  
本品为胸苷酸合成酶抑制剂。抗肿瘤药。适用于经紫杉醇和包括有蒽环类抗生素化疗方案治疗无效的晚期原发性或转移性乳腺癌的进一步治疗。是一种对肿瘤细胞有选择性活性的口服细胞毒类制剂，其本身无细胞毒性，但可转化为5-氟尿嘧啶而起作用。

1. 卡培他滨(154361-50-9)的制备方法：

1. 5'-脱氧-5-氟胞苷溶于干燥吡啶，在0°C和搅拌下加入乙酸酐，搅拌3h。减压蒸出溶剂，剩余物在乙酸乙酯和冰水之间进行分配。乙酸乙酯层以硫酸镁干燥，过滤，减压浓缩。剩余物硅胶柱层析后，再异丙醇重结晶，得2'，3'二-O-乙酰基-5'-脱氧-5-氟胞苷。

2. 将其溶于二氯甲烷和吡啶中，在冰浴冷却和搅拌下，滴加氯甲酸正戊酯，加毕，在室温搅拌30min。减压浓缩至干，剩余物在乙醚和碳酸氢钠水溶液之间进行分配。有机层用饱和盐水洗，干燥，过滤。滤液浓缩，得2'，3'二-O-乙酰基-5'-脱氧-5-氟-N4-(戊氧羰基)胞苷。

3. 将该产物溶于二氯甲烷，在冰浴冷却和搅拌下滴加1mol/L氢氧化钠溶液，加毕在0°C搅拌1h。加入甲醇，用浓盐酸调至pH为6。水层用95:5的二氯甲烷-甲醇提取多次，有机层合并，无水硫酸钠干燥，过滤。滤液浓缩，剩余物用乙

酸乙酯重结晶，得卡培他滨。

2. 适应证：

希罗达适用于紫杉醇和包括有蒽环类抗生素化疗方案治疗无效的晚期原发性或转移性乳腺癌的进一步治疗。

3. 推荐剂量：

每日2.500mg/m<sup>2</sup>，连用两周，休息一周。每日总剂量分早晚两次于饭后半小时用水吞服。如病情继续恶化或产生不能耐受的毒性时应停止治疗。

4. 卡培他滨(154361-50-9)治疗中剂量调整：

希罗达所引起的毒性有时需要做对症处理或对剂量进行调整（停药或减量）。一旦减量，以后不能再增加剂量。

以下是对毒性进行剂量调整时的推荐剂量（根据加拿大国家癌症研究所制定的常见毒性标准）。

1级、2级：

第一次出现：停止治疗，直到恢复至0-1级水平时，按维持剂量的100%进行下一疗程治疗。

第二次出现：停止治疗，直到恢复至0-1级水平时，按维持剂量的75%进行下一疗程治疗。

第三次出现：停止治疗，直到恢复至0-1级水平时，按维持剂量的50%进行下一疗程治疗。

第四次出现：永久停止治疗。

3级：

第一次出现：停止治疗，直到恢复至0-1级水平时，按维持剂量的75%进行下一疗程治疗。

第二次出现：停止治疗，直到恢复至0-1级水平时，按维持剂量的50%进行下一疗程治疗。

第三次出现：永久停止治疗。

4级：

永久停止治疗。

如停药后需继续治疗，则应考虑到病人的最大益处，且在毒性症状恢复至0-1级水平时以推荐剂量的50%进行使用。

5. 特殊人群的剂量调整：

肝功能不全：

对肝转移引起的轻度至中度肝功能不全的病人所进行的希罗达药代动力学研究表明，无需对这类病人做剂量调整。

肾功能不全：

尚未对肾功能不全者（指血清肌酐）进行希罗达药代动力学研究。

儿童：

生产方法及其他：尚未在儿童中进行希罗达的疗效与安全性研究。老年人：无须作剂量调整。但在老年人（65岁以上）比年轻人更容易对卡培他滨产生毒性，故应对其进行密切监测。

6. 禁忌症：

有希罗达严重副反应或对氟脲嘧啶（卡培他滨的代谢产物）有过敏史者禁用。

7. 卡培他滨(154361-50-9)的预防措施：

需限制剂量的毒性包括：腹泻、腹痛、恶心、胃炎及手足综合征。近半数接受希罗达治疗者会诱发腹泻，对发生脱水的严重腹泻者应严密监测并给予补液治疗。每日腹泻4-6次或者夜间腹泻者为2级腹泻，每日腹泻7-9次或大便失禁和吸收障碍者为3级腹泻，每日腹泻10次以上或有肉眼血便和需静脉补液者为4级腹泻。如发生2、3或4级腹泻，则应停用希罗达，直到腹泻停止或腹泻次数减少到1级时再恢复使用。3级或4级腹泻后再使用希罗达应减少用量。几乎近一半使用希罗达的病人发生手足综合征，但多为1-2级，3级综合征者不多见。多数副反应可以消失，尽管需要暂时停止用药或减少用量，但无须长期停止治疗。

8. 妊娠及哺乳妇女：

尚未在妊娠妇女中进行希罗达临床研究，但必须要考虑到如果在这类病人中使用希罗达，可能会引起胎儿损伤。动物实验表明卡培他滨能导致胎儿死亡或畸形。这些发现预示卡培他滨衍生物也具有这种作用，因此不能在妊娠妇女中使用希罗达。如在妊娠期间使用希罗达，或在使用希罗达期间发生妊娠时，必须考虑到该药对胎儿损伤或致畸的潜在危险性。生育期妇女使用希罗达时必须采取避孕措施。

尽管尚不知希罗达是否能分泌于奶液中，但由于许多药物能在奶液中分泌而有对哺乳的婴儿造成严重副反应的潜在危险性，因此建议使用希罗达的妇女停止授乳。

9. 卡培他滨(154361-50-9)的副反应：

希罗达的副反应较少，以下情况可能与之有关：

消化系统：希罗达最常见的副反应为可逆性胃肠道反应，如腹泻、恶心、呕吐、腹痛、胃炎等。

严重的(3-4级)副反应相对少见。

皮肤: 在几乎一半使用希罗达的病人中发生手足综合征: 表现为麻木、感觉迟钝、感觉异常、麻刺感、无痛感或疼痛感, 皮肤肿胀或红斑, 脱屑、水泡或严重的疼痛。皮炎和脱发较常见, 但严重者很少见。

一般不良反应: 常有疲乏但严重者极少见。其他常见的副反应为粘膜炎、发热、虚弱、嗜睡等, 但均不严重。

神经系统: 头痛、感觉异常、味觉障碍、眩晕、失眠等较常见, 但严重者少见。

心血管系统: 下肢水肿较轻且不常见。尚未见其他心血管系统副作用。

血液系统: 中性粒细胞减少且少见也不严重, 贫血极少见也不严重。

其他: 厌食及脱水常见, 但重者极少见。

#### 10. 联合用药:

希罗达与大量药物合用, 如抗组胺药, NSAIDs, 吗啡, 扑热息痛, 阿斯匹林, 止吐药, H2受体拮抗剂等, 未见具有临床意义的副作用。

蛋白结合: 卡培他滨与血清蛋白结合率较低(64%)通过置换与能蛋白紧密结合的药物发生相互作用的可能性尚无法预测。

与细胞色素P450酶间的相互作用: 在体外实验中, 未发现卡培他滨对人类肝微粒体P450酶产生影响。

#### 11. 卡培他滨(154361-50-9)的药物过量:

希罗达的临床试验中, 未发现由于药物过量而引起的副反应。但动物实验(对猴类以25, 679mg/m<sup>2</sup>/天的积极治疗)以及对人以最大耐受剂量(3, 514mg/m<sup>2</sup>/天)治疗中, 药物过量的表现为恶心、呕吐、腹泻、胃肠激惹、肠胃出血和骨髓抑制等。处理方法应包括使用利尿剂脱水治疗, 必要时透析治疗。

### 相关化学品信息

[15543-40-5](#) [1591-97-5](#) [150267-73-5](#) [2-苯基-4-硝基苯甲醚](#) [15411-45-7](#) [15878-75-8](#) [1570-27-0](#) [150840-69-0](#) [15749-33-4](#) [碘化钴](#) [152273-61-5](#) [4-乙酰胺基-3-硝基苯甲酸](#) [15057-50-8](#) [顺-1,3-戊二烯](#) [4-乙氧羰基-1-甲基-5-吡唑磺酰氨基甲酸乙酯](#) [氯化锑](#) [六偏磷酸钠](#) [纤维素醚](#)