



本PDF文件由 爱化学 ichemistry.cn 免费提供, 全部信息请点击[5536-17-4](#), 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:5536-17-4 基本信息

| | |
|------|--|
| 中文名: | 阿糖腺苷; 9-beta-D-阿拉伯呋喃糖基腺嘌呤 |
| 英文名: | Vidarabine |
| 别名: | 9-beta-D-Arabinosyladenine; (2R, 3S, 4S, 5R)-2-(6-Aminopurin-9-yl)-5-(hydroxymethyl)oxolane-3, 4-diol |



| | |
|------------|---|
| 分子式: | C ₁₀ H ₁₃ N ₅ O ₄ |
| 分子量: | 267.24 |
| CAS登录号: | 5536-17-4 |
| EINECS登录号: | 226-893-9 |

安全信息

| | |
|--------|----------------------|
| 安全说明: | S36/37: 穿戴合适的防护服和手套。 |
| 危险品标: | Xn: 有害物质 |
| 危险类别码: | R63: 可能危害未出生婴儿。 |

CAS#5536-17-4化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

百灵威科技有限公司 专业从事5536-17-4及其他化工产品的生产销售 400-666-7788
 大连美仑生物技术有限公司 阿糖腺苷专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 0411-82593631、82593920
 江苏信达医药科技有限公司 长期供应9-beta-D-阿拉伯呋喃糖基腺嘌呤等化学试剂, 欢迎垂询报价 86-512-63009836

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. 5536-17-4](#) 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: **阿糖腺苷(5536-17-4)的用途:**
 本品用于治疗慢性乙型肝炎、单纯疱疹病毒性脑炎、带状疱疹、生殖器疱疹、新生儿单纯疱疹感染、免疫缺陷病人的水痘-带状疱疹感染、疱疹性脊髓炎、角膜炎及角膜色素层炎、巨细胞病毒性肺炎。

1. 阿糖腺苷(5536-17-4)的制备:

(1) 方法一:

以5'-腺嘌呤核苷酸(5'-AMP)为原料。

经选择性对**甲苯磺酰化**, 水解脱**磷**, 溴化, 乙酰化得8-羟基-N, 3', 5'-O-三乙基-2'-O-对**甲苯磺酰基腺苷**, 在**甲醇**-氨中环化, 再在**甲醇-硫化氢**中开环得8-巯基阿糖腺苷, 经氢解脱硫即可得本品。

5'-腺嘌呤核苷酸[对**甲苯磺酰氯**]→2'-O-对**甲苯磺酰基腺苷**-5'-单**磷酸酯**[**氨水**, 甲酰胺]→2'-O-对**甲苯磺酰基**

腺苷酸[Br₂]-8-溴-2'-O-对甲苯磺酰基腺苷[乙酸, 醋酐]-8-羟基-N, 3', 5'-O-三乙基-2'-O-对甲苯磺酰基腺苷[甲醇氨]-8, 2'-O-环化腺苷[甲醇-硫化氢]-8-巯基阿糖腺苷[兰尼德]->本品

(2) 方法二:

以尿苷为原料。

先与三氯化磷和二甲基甲酰胺反应, 然后在碱性(pH=9)条件下水解得到阿糖尿苷, 经嘧啶核苷磷酸化酶水解, 温度60℃, 脱去尿嘧啶得到阿糖-1-磷酸, 经嘌呤核苷磷酸化酶催化, 与腺嘌呤在60℃缩合得本品。

尿苷[三氯化磷, 二甲基甲酰胺]->[pH9]阿糖尿苷[嘧啶核苷磷酸化酶]->[60℃]阿糖-1-磷酸[嘌呤核苷磷酸化酶]->[60℃]本品。

2. 阿糖腺苷(5536-17-4)的药理和应用:

本品分子结构本品静滴后在人体内迅速去氨成为阿拉伯糖次黄嘌呤, 具有抑制病毒DNA合成功能。对疱疹病毒、水痘、带状疱疹病毒、腺病毒、伪狂犬病毒等DNA病毒有抑制作用。对大多数RNA病毒无效。临床用于慢性乙型肝炎, 带状疱疹性脑炎及疱疹性角膜炎等。

体内过程: 静滴12小时后可达血浓高峰、能广泛分布于各组织、如肝、肾等, 并小部分透过血脑屏障。本品60-80%以代谢物形成少部分以原形药物由尿中排出。

静滴后, 在体内迅速去氨成为阿拉伯糖次黄嘌呤, 并迅速分布进入一些组织中。按10mg/kg剂量缓慢静滴给药, 阿拉伯糖次黄嘌呤的血浆峰值为3~6μg/ml, 本品则为0.2~0.4μg/ml。阿拉伯糖次黄嘌呤可透过脑膜, 脑脊液与血浆中的浓度比为1:3。每日用41%~53%, 以阿拉伯糖次黄嘌呤形式为主自尿排泄, 母体化合物只有1%~3%。肾功能不全者, 阿拉伯糖次黄嘌呤在体内蓄积, 其血浆浓度可为正常人的几倍。阿拉伯糖次黄嘌呤的平均t_{1/2}为3.3小时。

有抗单纯疱疹病毒HSV1和HSV2作用, 用以治疗单纯疱疹病毒性脑炎, 也用于治疗免疫抑制病人的带状疱疹和水痘感染。但对巨细胞病毒则无效。本品的单磷酸酯有抑制乙肝病毒复制的作用。

3. 常用剂型:

注射液(混悬液): 200mg(1ml); 1000mg(5ml)。加入输液中滴注用。注射用单磷酸阿糖腺苷: 每瓶200mg。眼膏: 3%。

4. 使用方法:

(1) 单纯疱疹病毒性脑炎1日量为15mg/kg, 按200mg药物、500ml输液(预热至35~40℃)的比率配液, 作连续静脉滴注, 疗程为10日。

(2) 带状疱疹10mg/kg, 连用5日, 用法如上。

5. 不良反应:

(1) 消化道反应, 如恶心、呕吐、厌食、腹泻等较常见。中枢系统反应, 如震颤、眩晕、幻觉、共济失调、精神变态等, 也偶见。尚有氨基酸转移酶升高, 血胆红素升高、血红蛋白减少、红细胞压积下降、白细胞减少等反应。

(2) 用量超过规定时, 出现的反应较严重。

(3) 大量液体伴随本品进入体内, 应注意水、电解质平衡。

(4) 本品不可静脉推注或快速滴注。

(5) 配得的输液不可冷藏以免析出结晶。

6. 抑制作用:

生产方法及其他: 别嘌呤醇有黄嘌呤氧化酶抑制作用, 使阿拉伯糖次黄嘌呤的消除减慢而蓄积, 可致较严重的神经系统毒性反应。

7. 治疗乙型肝炎:

阿糖腺苷阿糖腺苷及单磷酸化合物均属嘌呤核苷, 有较强的抗病毒作用。已证明本品主要作用是抑制病毒的去氧核糖核酸聚合酶的作用大于对人体细胞去氧核糖核酸聚合酶的作用。因此在治疗浓度时能优先抑制病毒去氧核糖核酸合成, 而对人体细胞毒性相对较低。本品抑制乙肝病毒去氧核糖核酸聚合酶的水平快而明显, 比干扰素好; 但抑制作用维持时间短暂, 停药后易反跳, 因此在对抗乙肝病毒的持续复制方面又次于干扰素; 本品的水溶性低, 临床应用时必须大量稀释至0.7mg/mL以下时才能作静脉点滴, 静注该药后30分钟, 血内浓度达高峰, 但停止滴注后, 血浆药物浓度很快下降, 在15-20分钟后即测不到。改用单磷酸化合物制剂后溶解度为本品的100-400倍, 可作肌肉注射和静脉滴注, 当肌肉注射后。需3小时, 血浓度才达峰。

用法: 每天10-15mg/kg体重, 稀释在1000mL 15%-10%葡萄糖液内, 12小时内缓慢静滴, 疗程10-30天, 也有将剂量减为每天5-10mg/kg体重, 认为疗效相同。

阿糖腺苷单磷酸化合物(Ara-AMP)每天5—10mg/kg体重,分2次肌肉注射,疗程同上,也可延长8周。经治疗乙型肝炎病毒的e抗原阴转后,e抗体阳性的血清转换率在5%—55%之间。大剂量应用可有发热、恶心、呕吐、血小板减少及下肢肌肉强直的肌病综合征等不良反应。2007年美国报道,阿糖腺苷单磷酸化合物虽有较强的抗病毒作用,能一过性降低乙肝病毒的血清水平,但用该药治疗乙型肝炎超过1个月后,可出现较高的神经毒性,因此不宜随便应用。

8. 阿糖腺苷(5536-17-4)的实验:

关于本品,有人(Whitley, 1980)曾试用于31例新生儿单纯疱疹病毒感染,并输液时间不少于12小时。结果:全身播散性患儿:治疗组8/14(57%)病死,对照组11/13(85%)病死。幸存者中,治疗组4/6有后遗症(1例有痉挛,2例有小头、癫痫发作、痉挛、失明,1例有严重脑损伤及尿崩症),对照组中1/2有后遗症(小头、癫痫发作、失明、耳聋)。故总的看来此型的预后不好。但中枢神经系统感染型则不同,病死率治疗组仅1/10,而对照组则为3/6;后遗症治疗组为4/9(小头、癫痫发作、痉挛及失明),对照组2/3(1例偏瘫,1例小头、痉挛)。如将两型合并计算,则治疗组有7/24(29%)小儿健在,对照组仅2/19(11%)。提示,本品治疗确有一定好处。

至于单纯疱疹型,治疗组似亦较对照组为优,两组虽均无病死者,但对对照组8例中有3例,其皮肤、粘膜疱疹恢复后1年内却发生了脉络膜视网膜炎和/或神经系统损害,其中2例发展至痉挛和失明,1例发展为小并没有及痉挛。眼中未分离到病毒,也一直没有中枢神经系统感染的临床表现或脑脊液异常。提示有些单纯疱疹性中枢神经系统感染可能是亚临床型的,这些患儿以后仍可能发生神经系统损害和智力障碍,值得注意。单纯疱疹型治疗组有4例,均健在,仅1例于2岁时发生了轻度的脉络膜视网膜炎。提示,即使是单纯疱疹型患儿似亦值得进行本品的治疗。在整个治疗过程中,作者未观察到像成人治疗过程中的那些胃肠道及神经系统毒性反应,也未见到对骨髓、肝、肾功能的影响,血红蛋白、白细胞、肌酐、[尿素氮](#)也均与对照组同。其他报告也均证实本品对疱疹病毒感染有较好的治疗作用,如有人(Whitley, 1981)两次报告本药单纯疱疹性脑炎的效果,第一次18例,第二次75例,诊断均经脑活检病毒分离证实。治疗后1月的病死率分别为28%及33%,而对照组为70%。治疗组共存活56例,其中30例正常。16例有中度后遗症,10例有严重后遗症。

9. 储运:

库房通风低温干燥。

10. 灭火剂:

干粉,泡沫,沙土, [二氧化碳](#), 雾状水。

11. 其他:

- ①疏水参数计算参考值(XlogP): -1.1;
- ②氢键供体数量: 4;
- ③氢键受体数量: 8;
- ④可旋转化学键数量: 2;
- ⑤互变异构体数量: 3;
- ⑥拓扑分子极性表面积(TPSA): 140。

相关化学品信息

[马来酰胺酸](#) [花生酸酐](#) [55750-00-0](#) [DL-去甲肾上腺素盐酸盐](#) [55844-94-5](#) [55069-41-5](#) [55162-49-7](#) [5516-73-4](#) [2-氯丙烯](#) [55349-54-7](#) [5-溴-2-乙氧基吡啶](#) [55682-81-0](#) [55558-90-2](#) [55727-10-1](#) [5569-46-0](#) 411

生成时间2014-1-22 20:57:53