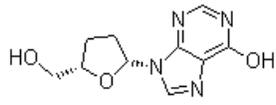


本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[69655-05-6](#), 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.icchemistry.cn](#)

## CAS Number:69655-05-6 基本信息

中文名:	地丹诺辛; 地达诺辛; 2',3'-双脱氧肌苷; 2',3'-双脱氧肌甙
英文名:	Dideoxyinosine
别名:	2',3'-Dideoxyinosine
分子结构:	
分子式:	C <sub>10</sub> H <sub>12</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub>
分子量:	236.23
CAS登录号:	69655-05-6

## 物理化学性质

熔点:	175°C
水溶性:	1-5G/100MLAT21°C
性质描述:	熔点175°C。

## 安全信息

安全说明:	S26: 万一接触眼睛, 立即使用大量清水冲洗并送医诊治。 S27: 立刻除去所有污染衣物。 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)。 S36/37/39: 穿戴合适的防护服、手套并使用防护眼镜或者面罩。
危险类别码:	R34: 会导致灼伤。 R36/37: 对眼睛和呼吸道有刺激作用。

## CAS#69655-05-6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69655-05-6及其他化工产品的生产销售 800-736-3690  
 梯希爱(上海)化成工业发展有限公司 地丹诺辛专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 800-988-0390  
 深圳迈瑞尔化学技术有限公司(代理ABCR) 长期供应地达诺辛等化学试剂, 欢迎垂询报价 0755-86170099  
 萨恩化学技术(上海)有限公司 生产销售2',3'-双脱氧肌苷等化工产品, 欢迎订购 021-58432009  
 阿达玛斯试剂 是以2',3'-双脱氧肌甙为主的化工企业, 实力雄厚 400-111-6333  
 阿凡达化学 本公司长期提供C10H12N4O3等化工产品 400-615-9918

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. 69655-05-6](#) 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:	抗癌药, 抗爱滋病毒。
	1. 去羟肌苷(69655-05-6)的制备方法: 1. 制备方法一:

在搅拌下,将2.15kg肌苷加到5.27kg 2-乙酰氧基-2-甲基丙酰氯和7.2kg碘化钠在40L乙腈的溶液中,搅拌30min。将反应液倾入饱和碳酸氢钠水溶液中,用乙酸乙酯提取。提取液用亚硫酸氢钠水溶液和饱和氯化钠水溶液洗,浓缩。剩余物溶于48L吡啶-丙酮(1:2)的混合液中,加入锌-铜复合物(由6.0kg锌粉和2%硫酸铜反应得到),彻底搅拌。然后移出未反应的锌-铜复合物,先用Amberlite IRC 718,再用10%氨/甲醇处理,得到55%的化合物(VI)。将其溶于2%氨水中,在Raney镍存在下氢化,得到38.5%的去羟肌苷。

## 2. 制备方法二:

6-羟基嘌呤(hypoxanthine)和2',3'-二脱氧胞啶(2',3'-dideoxycytidine)、2',3'-二脱氧尿核昔(2',3'-dideoxyuridine)或3'-脱氧胸腺嘧啶核苷(3'-deoxythymidine),在Escherichia(如Escherichia coliJA-300)、Klebsiella或Erwinia存在下,在磷酸缓冲水溶液中,进行发酵,可以得到去羟肌苷。

## 2. 去羟肌苷(69655-05-6)的规格:

25、50、100、150和200 mg等规格,每片中所含的缓冲剂为碳酸钙和氢氧化镁,此外尚含无活性成分天冬酰胺、山梨醇、微晶纤维素、聚乙烯吡咯烷酮、硬脂酸镁等。去羟肌苷缓冲剂为单剂量,儿童安全的铝箔包装,有100、167和250 mg几种规格,内含枸橼酸-磷酸缓冲剂(包括磷酸氢二钠、枸橼酸钠和枸橼酸)和蔗糖。去羟肌苷小儿口服粉剂有4盎司和8盎司两种玻璃瓶装规格,分别含有2 g和4 g去羟肌苷药粉。

## 3. 去羟肌苷(69655-05-6)的药理作用:

能抑制HIV的复制。在细胞酶的作用下转化为具有抗病毒活性的代谢物双去氧三磷酸腺苷(ddATP),为人类免疫缺陷病毒(HIV)复制抑制剂。其作用机制与齐多夫定相似。去羟肌苷吸收迅速,口服给药后一般在0.25-1.5 hr内达血药峰浓度。

## 4. 适应证:

与其他抗病毒药物联合使用,用于治疗I型HIV感染。艾滋病的治疗

## 5. 去羟肌苷(69655-05-6)的不良反应:

本品的严重毒性是胰腺炎,其他重要的毒性还有乳酸性酸中毒,脂肪变性重度肝肿大,视网膜病变和视神经炎,以及外周神经病变。在临床实验中,发生率较高的不良反应有腹泻、神经病变、皮疹/瘙痒、腹痛、胰腺炎、头痛、恶心、呕吐。在临床实验中,发生率较高的实验室异常有:SGPT或SGOT升高(大于正常上限值的5倍)、碱性磷酸酶升高(大于正常上限值的5倍)、淀粉酶升高(大于正常上限值的1.4倍)、尿酸升高(>12 mg/dl)、胆红素升高(大于正常上限值的2-2.6倍)、脂肪酶升高(大于正常上限值的2倍)。临床:全身反应-脱发、过敏反应、无力、疼痛、寒战和发热。消化系统-厌食、消化不良和腹泻。外分泌腺-胰腺炎、唾液腺炎、腮腺肿大、口干、眼干。造血系统-贫血、白细胞缺乏症、血小板缺乏症。肝脏-乳酸性酸中毒和肝脏脂肪变性,肝炎和肝功能衰竭。代谢-糖尿病、高血糖或低血糖。肌肉骨骼系统-肌肉疼痛(伴有或不伴有肌酸磷酸激酶升高)、引起肾功能衰竭而需血液透析的横纹肌溶解,关节痛和肌肉病变。儿童中发生的不良反应及严重的实验室检查异常的类型和发生率均与成人的相同。

## 6. 相互作用:

药物的相互作用研究表明,本药与daspono、洛哌丁胺、甲氧氯普胺、nirvrapine、雷尼替丁、利福布丁、利托那韦、司坦夫定、磺胺甲恶唑、甲氧苄啶和齐夫多定,在药代动力学上均无临床相互作用。

## 7. 去羟肌苷(69655-05-6)的用法用量:

成人:体重≥60 kg者,片剂的推荐剂量为200 mg bid或400 mg qd,缓冲粉剂为250 mg bid。体重<60 kg者,片剂的推荐剂量为125 mg bid或250 mg qd,缓冲粉剂为167 mg bid。儿童:推荐剂量为120 mg/m<sup>2</sup>,每日2次。儿童每日1次的治疗方案尚未确定。本药应在餐前至少30分钟给药,或在进食2小时后空腹服用。无论是每日1次还是每日2次,为提供足够的缓冲液以防止去羟肌苷在胃内被酸降解,每次至少应服用2片相应的剂量。200 mg规格的片剂只用于每日1次治疗方案。为避免胃肠道不良反应,每次用量不应超过4片。肾功能损害者推荐剂量如下:肌酐清除率>60 mL/分,体重≥60 kg者,给予片剂400 mg qd或200 mg bid(缓冲粉剂250 mg bid),体重<60 kg的患者,给予片剂250 mg qd或125 mg bid(缓冲粉剂167 mg bid);肌酐清除率为30-59 mL/分,体重≥60 kg的患者,给予片剂200 mg qd或100 mg bid(缓冲粉剂100 mg bid),体重<60 kg的患者,给予片剂150 mg qd或75 mg bid(缓冲粉剂100 mg bid);肌酐清除率10-29 mL/分,体重≥60 kg者,给予片剂150 mg qd(缓冲粉剂167 mg qd),体重<60 kg的患者,给予片剂或缓冲粉剂100 mg qd;肌酐清除率<10 mL/分,体重≥60 kg的患者,给予片剂或缓冲粉剂100 mg qd,体重<60 kg的患者,给予片剂75 mg qd(缓冲粉剂100 mg qd)。对儿童肾功能损害者,尚无实验数据表明需调整剂量,但可考虑减少剂量或延长用药间隔。连续腹膜透析或血液透析的病人建议使用?常规用量。血液透析后,不需要再补充给药。本药用药过量尚无已知的解毒药。在I期临床研究中,初始剂量为目前推荐剂量的10倍,发生的毒性有:胰腺炎、外周神经病变、腹泻、高尿酸血症和肝功能减退。去羟肌苷不能通过腹膜透析排出,而血液透析能排出少量去羟肌苷。咀嚼/分散片:成人片剂应充分咀嚼,或在服用前溶解在至少1盎司的水中,搅拌直至完全均匀,立即饮用全部溶液。若需要另外调味,溶液可用1盎司的苹果汁稀释,服用前再次搅拌后立即服用。加有苹果汁

生产方法及其他:

200 mg qd或100 mg bid(缓冲粉剂100 mg bid),体重<60 kg的患者,给予片剂150 mg qd或75 mg bid(缓冲粉剂100 mg bid);肌酐清除率10-29 mL/分,体重≥60 kg者,给予片剂150 mg qd(缓冲粉剂167 mg qd),体重<60 kg的患者,给予片剂或缓冲粉剂100 mg qd;肌酐清除率<10 mL/分,体重≥60 kg的患者,给予片剂或缓冲粉剂100 mg qd,体重<60 kg的患者,给予片剂75 mg qd(缓冲粉剂100 mg qd)。对儿童肾功能损害者,尚无实验数据表明需调整剂量,但可考虑减少剂量或延长用药间隔。连续腹膜透析或血液透析的病人建议使用?常规用量。血液透析后,不需要再补充给药。本药用药过量尚无已知的解毒药。在I期临床研究中,初始剂量为目前推荐剂量的10倍,发生的毒性有:胰腺炎、外周神经病变、腹泻、高尿酸血症和肝功能减退。去羟肌苷不能通过腹膜透析排出,而血液透析能排出少量去羟肌苷。咀嚼/分散片:成人片剂应充分咀嚼,或在服用前溶解在至少1盎司的水中,搅拌直至完全均匀,立即饮用全部溶液。若需要另外调味,溶液可用1盎司的苹果汁稀释,服用前再次搅拌后立即服用。加有苹果汁

的溶液在室温17-23°C可稳定1小时。口服缓冲粉剂：将药粉倒入4盎司饮用水中，搅拌2-3分钟直至完全溶解，立即服用。不要加果汁或其他酸性溶液。小儿口服缓冲粉剂：首先必须将药粉配成20 mg/mL的初始溶液，再加入抗酸成分，使最终浓度为10 mg/mL。步骤如下：在药瓶中，2 g或4 g药粉分别加入100 mL或200 mL纯水，配成20 mg/mL的初始溶液，立即把1份20 mg/mL的初始溶液或是和双倍浓度的Mylanta溶液混合，或是用Mylanta TC混悬液配制成10 mg/mL的终混合液。此混合液应分装于大小合适的密闭玻璃或塑料容器(HDPE、PET或PETG)中，置于冰箱内保存，2-8°C下最多可存放30天。每次使用前应轻摇，使混合液充分混匀。

#### 8. 去羟肌苷(69655-05-6)的注意事项：

对去羟肌苷和其他配方成分有明显过敏的患者禁用。胰腺炎 合用司坦夫定的患者，无论是否合用羟基腺，发生胰腺炎的可能性较大。有胰腺炎危险因素的患者，尽量避免使用本药，必需使用时，务必谨慎。肾功能损害的患者，若剂量不作调整，也较容易发生胰腺炎。胰腺炎的发生率与剂量有关高剂量时，发生率为13%(5/38)。儿童患者出现胰腺炎的症状和体征时，应暂停使用本品，一旦确诊为胰腺炎，应禁用去羟肌苷。乳酸性酸中毒和脂肪变性重度肝肿大情况多发生在女性，肥胖和长期的核苷摄入可能是引起上述情况的危险因素。若有患肝脏疾病的危险因素，患者应慎用本药。因这些情况也发生于无危险因素的患者，所以用药时也需密切监测临床或实验室检查结果，一旦出现乳酸中毒或明显的肝毒性(包括肝肿大和脂肪变性，转氨酶可能不升高)，应暂缓治疗。视网膜病变和视神经炎在成人和儿童患者中，均有视网膜病变和视神经炎发生。服用本药的患者应定期接受视网膜检查。外周神经病变服用本品治疗的病人可出现外周神经病变，表现为手足麻木刺痛。HIV感染的晚期患者、有神经病变病史，以及同时使用如司坦夫定等神经毒性药物的患者，较易发生外周神经病变。如在疗程中发生了外周神经变的症状，待中毒症状消退后，患者仍能耐受减量的本药治疗。重复使用本药治疗后，若再出现外周神经病变，需考虑完全停止本药治疗。**苯丙酮**尿症患者：每片去羟肌苷咀嚼/分散片中含**苯丙氨酸**36.5 mg。限制钠盐摄入量的患者：去羟肌苷缓冲粉剂单剂量包装含1380 mg的钠。肾功能损害患者(肌酐清除率<60 mL/分)：因药物的清除率降低，较易发生毒性反应，因此，对这类患者应减少本药的用量。去羟肌苷分散片含8.6 mEq的镁，若长期使用，会加重患者的镁负荷。肝功能损害患者：肝功能的减退是否影响去羟肌苷的药代动力学尚不明确，使用本药时应监测其毒性。另外，本药与无症状高尿酸血症相关，若不能降低血中的尿酸浓度，必须暂停使用本药。应告知患者，去羟肌苷与其它有相似毒性的药物合用时，其不良反应比单用本药易发生。与某些药物合用或饮酒，可能增加本药的毒性。为保证胃内的酸中和，每次至少应服用2片，但不宜超过4片，避免过多的抗酸成分引起胃肠道副作用。另外，还应告知患者，本药并不能治愈HIV感染，患者仍可能继续发展产生与艾滋病或ARC相关的疾病，包括机会致病菌感染。另外，本药也不能预防HIV通过性接触或血液污染而造成传染。

#### 9. 其它：

- 1、疏水参数计算参考值(XlogP)：-1.2
- 2、氢键供体数量：2
- 3、氢键受体数量：5
- 4、可旋转化学键数量：2
- 5、拓扑分子极性表面积(TPSA)：88.7
- 6、重原子数量：17

远离氧化物，热和光。存放在密封容器内，并放在阴凉，干燥处。储存的地方必须远离氧化剂。

#### 相关化学品信息

[1-氨基-1-环丙烷羧酸](#) [2-溴-4-氯苯酚](#) [6901-97-9](#) [69991-67-9](#) [3,3-二甲基-1,5-二氧杂螺\[5.5\]十一烷-9-酮](#) [吡啶-N-氧化物](#) [6-硝基-2,5-二氨基吡啶](#) [二氯苯肿](#) [69557-20-6](#) [6919-62-6](#) [696-83-3](#) [2,4,6-三氟-5-氯嘧啶](#) [6907-68-2](#) [6957-50-2](#) [6957-24-0](#) [苯醚](#) [氧化钪](#) [甲醇](#)