



本PDF文件由

免费提供, 全部信息请点击[99011-02-6](#), 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.ichemistry.cn](#)

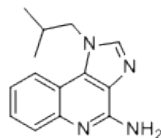
## CAS Number:99011-02-6 基本信息

中文名: 咪喹莫特;  
1-(2-甲基丙基)-4-氨基-1H-咪唑并[4,5-c]喹啉

英文名: Imiquimod

别名: 4-Amino- 1-isobutyl-1H-imidazo[4,5-c]quinoline;  
1-(2-Methylpropyl)-1H-imidazo[4,5-C]quinolin-4-amine

分子结构:

分子式:  $C_{14}H_{16}N_4$ 

分子量: 240.30

CAS登录号: 99011-02-6

## 物理化学性质

性质描述: 咪喹莫特的性状:  
本品的熔点293~295℃。

## CAS#99011-02-6化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

梯希爱(上海)化成工业发展有限公司 专业从事99011-02-6及其他化工产品的生产销售 800-988-0390  
萨恩化学技术(上海)有限公司 咪喹莫特专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 021-58432009  
阿凡达化学 长期供应1-(2-甲基丙基)-4-氨基-1H-咪唑并[4,5-c]喹啉等化学试剂, 欢迎垂询报价 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. 99011-02-6](#) 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: 抗尖锐湿疣、免疫调节剂

## 1. 咪喹莫特(99011-02-6)的制备方法:

4-羟基-2-(1H)-[喹啉酮](#)和[冰醋酸](#)混合, 冷却至-5℃, 滴加发烟[硝酸](#), 在冰盐冷却下搅拌1h, 再常温下搅拌2h。将反应液倒入到冰中, 搅拌1h。过滤, 滤饼[水洗](#)至近中性, 干燥, 二甲基甲酰胺重结晶, 得3-硝基-4-羟基-2-(1H)-喹啉酮。

1. 将其和[三氯氧磷](#)混合, 冷却至-5℃, 滴加[吡啶](#), 再常温下反应2h, 热至回流反应6h。放冷至50℃以下, 倒入到冰中, 搅拌1h。该混合液用[氯仿](#)提取, 提取液用水和盐水洗, 干燥。过滤, 浓缩至小体积使固体析出。过滤, 干燥, [氯仿](#)重结晶, 得3-硝基-2, 4-二氯喹啉。

2. 将其溶于[乙醇](#), 加入[三乙胺](#), 滴加异丁胺, 控制滴加速度使反应液的温度小于75℃, 滴完在65~75℃反应12h。减压回收大部分[乙醇](#), 反应液倒入冰水中, 搅拌2h。过滤, 干燥, 得2-氯-3-硝基-4-异丁胺基喹啉。将其溶于无水乙醇。加入Raney Ni, 50~60℃下常压氢化至不再吸氢(约需12~14h)。静置, 将上部溶液倾出, 加入乙醇, 摇动后静置。倾出上部清液, 合并倾出液, 浓缩至小体积, 静置。过滤, 乙醇重结晶, 得2-氯-3-氨基-4-异丁胺基喹啉。

3. 将其和原[甲酸](#)三乙酯在80℃反应约16h, 加入氯仿, 搅拌0.5h。氯仿层水洗, 饱和盐水洗, 干燥。浓缩至小体积, 放置。过滤, [乙酸乙酯](#)重结晶, 得1-(2-甲基丙基)-4-氯-1H-咪唑并[4,5-c]喹啉。将其和甲氧基乙醇、[氨水](#)混合后密闭在高压釜中(压力约为0.9MPa), 加热至100℃, 反应4h, 过滤, 用溶剂洗滤饼, 干燥。用二甲基甲酰胺

<p>生产方法及其他:</p>	<p>胺重结晶，得产物。</p> <p>2. 咪喹莫特 (99011-02-6) 的药理、毒理研究：</p> <p>1. 药效学</p> <p>咪喹莫特，属咪唑喹啉类化合物。是一个小分子免疫调节剂。其治疗外生殖器/肛周疣的作用机制尚不清楚。本品不具有直接抗病毒活性，也不引起直接的、非特异的细胞溶解破坏作用。但临床前研究提示本品可能通过诱导体内包括INF-<math>\alpha</math>在内的细胞因子而产生抗病毒活性。这些发现的临床相关性尚不清楚。</p> <p>2. 毒理学</p> <p>大鼠和小鼠皮肤给药，每周3次，连给4个月。大鼠0.5和2.5mg/kg可见体重下降，脾重量增加。局部皮肤刺激(严重红斑、轻到中度水肿、脱皮、结痂)比在人身上观察到的严重。组织病理学检查可见上皮溃疡和角化过度等上皮炎症，没有观察到无副反应的剂量。小鼠皮肤给药4个月未见上述变化。小鼠0.4mg/kg (大约临床人用剂量的2倍)是安全剂量。</p> <p>致突试验表明：没有一个遗传毒理学试验发现咪喹莫特有诱变活性。</p> <p>用大鼠所做的生殖毒性试验结果显示，不影响生殖。在哺乳期间动物的存活和生长都是正常的。不影响子代交配。在大鼠或家兔的致畸研究中，没有发现咪喹莫特有致畸作用。</p> <p>3. 药代动力学：</p> <p>没有可以利用的皮肤给药的药代动力学资料。研究表明，局部应用5% 咪喹莫特乳剂，通过皮肤全身吸收很少。</p> <p>4. 适应症：</p> <p>5% 咪喹莫特乳剂局部用于治疗成人外生殖器和肛门的疣/尖锐湿疣。现在部份医生用于治疗皮肤癌，基底细胞癌等。</p> <p>5. 咪喹莫特 (99011-02-6) 的用法用量：</p> <p>1. 咪喹莫特每周3次(星期一、三、五或二、四、六)，临睡前用药。在医生指导下合理用药以发挥本品的最大疗效。建议用药前和用药后洗手。咪喹莫特多采用管状(丽科杰)或多剂量包装(明欣利迪)，每管乳膏3g可涂抹面积为240平方厘米的疣体，避免过量使用本品，前一周使用尽量少，薄薄一层为宜。</p> <p>2. 睡前取适量咪喹莫特药膏，均匀涂抹一薄层于疣体部位，轻轻按摩直到药物完全吸收，并保留6-10小时，用药部位不要封包。</p> <p>3. 在涂咪喹莫特药膏后6-10小时请勿洗澡，6-10小时后，用清水和中性肥皂将药物从疣体部位洗掉；</p> <p>4. 患者应持续使咪喹莫特药膏，直到疣体完全清除，疣体最快2-4周清除，一般多在8-12周清除，用咪喹莫特药最多不超过16周。</p> <p>5. 用咪喹莫特药后局部有轻度红斑者，可不必停咪喹莫特而持续使用；如患者感到全身不适或出现较为明显的局部皮肤反应(如较明显的水肿、糜烂、疼痛等)时，应停用药物数次，待反应减轻后再继续用咪喹莫特。</p> <p>6. 咪喹莫特 (99011-02-6) 的不良反应：</p> <p>局部皮肤反应例如：红斑、糜烂、剥脱/剥落和水肿是很常见的。严重的皮肤反应一旦发生，用药部位应用弱碱肥皂和水将乳膏剂洗掉，皮肤反应恢复后可重新再用5%咪喹莫特乳膏剂。少数患者也有肌痛、流感样症状、头痛、腹泻等全身反应均为轻度和中度。</p> <p>7. 禁忌症：</p> <p>1. 对咪喹莫特或赋形剂过敏者；</p> <p>2. 不推荐用于尿道、阴道内、子宫颈、直肠或肛门内的HPV感染；</p> <p>3. 不推荐在其它药物或外科治疗后立即使用5% 咪喹莫特乳膏剂治疗；也不推荐5% 咪喹莫特乳膏剂与其它治疗外生殖器疣的药配伍使用。</p> <p>8. 咪喹莫特 (99011-02-6) 的注意事项：</p> <p>1. 需要经医生指导后使用。本品为外用药，应避免与眼接触。</p> <p>2. 治疗部位不需用绷带等覆盖。</p> <p>3. 5%咪喹莫特乳膏剂可减弱避孕套的避孕效果，因此在用药时应避免性接触。</p> <p>4. 对于包皮过长的男病人，目前尚无推荐的治疗方案，故不推荐这种病人使用。</p> <p>5. 在用药部位及周围皮肤的反应，例如红斑、剥脱/剥落、糜烂和水肿是很常见的。大部分皮肤反应是轻度和中度，严重的皮肤反应一旦发生应及时报告医生。</p> <p>6. 病人需知道，在治疗期间新的疣有可能长出，因为5%乳膏剂不能治愈疣。大于75岁或小于18岁年龄范围的人</p>
-----------------	---

群没有用药经验。

9. 孕妇及哺乳期妇女用药：

1. 不推荐孕妇应用本品。

2. 不知道局部应用咪喹莫特后乳汁中是否有药物分泌，不推荐哺乳期妇女应用本品。

10. 儿童用药：

没有18岁以下患者用药经验。

11. 咪喹莫特(99011-02-6)的药物过量：

人用5%咪喹莫特乳剂一般不可能过量，因为皮肤吸收非常少。动物实验证实，家兔皮肤给药致死剂量大于1600mg/m<sup>2</sup>。持续过量局部使用5%咪喹莫特乳剂，可引起严重的局部皮肤反应。临床多次口服给药剂量>200mg副作用为低血压，低血压只发生在口服或静脉给药。

相关化学品信息

[1,2,3,9-四氢-3-\[\(2-甲基-1H-咪唑-1-基\)甲基\]-4H-吡嗪-4-酮](#) [992-69-8](#) [99055-68-2](#) [3-硝基甲苯](#) [尼泊金甲酯](#) [1-氯乙基环己基碳酸酯](#) [99974-32-0](#) [4-氯吡啶-2-甲酰胺](#) [99189-00-1](#) [苯红紫4B](#) [99012-36-9](#) [3,5-二甲基硝基苯](#) [4-溴苯乙酮](#) [3-硝基-4-羟基苯甲酸甲酯](#) [替卡硼烷钴钠](#) [甲酸铯供应](#) [硼酸钾](#) [四硼酸钠](#) 497