

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: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°C。
-------	-----------------------------

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
	<p>1. 咪喹莫特(99011-02-6)的制备方法:</p> <p>4-羟基-2-(1H)-喹啉酮和冰醋酸混合, 冷却至-5°C, 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。</p> <p>1. 将其和三氯氧磷混合, 冷却至-5°C, 滴加吡啶, 再常温下反应2h, 热至回流反应6h。放冷至50°C以下, 倒入冰中, 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。</p> <p>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°C, 滴完在65~75°C反应12h。减压回收大部分乙醇, 反应液倒人冰水中, 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°C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, 摆动后静置。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。</p> <p>3. 将其和原甲酸三乙酯在80°C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°C, 反应4h, 过滤, 用溶剂洗滤饼, 干燥。用二甲基甲酰</p>

胶重结晶, 得产物。

2. 咪喹莫特(99011-02-6)的药理、毒理研究:

1. 药效学

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- α 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。

2. 毒理学

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。

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。

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。

3. 药代动力学:

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。

4. 适应症:

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。

生产方法及其他: 5. 咪喹莫特(99011-02-6)的用法用量:

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。

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。

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;

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。

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。

6. 咪喹莫特(99011-02-6)的不良反应:

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。

7. 禁忌症:

1. 对咪喹莫特或赋形剂过敏者;

2. 不推荐用于尿道、阴道内、子宫颈、直肠或肛门内的HPV感染;

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。

8. 咪喹莫特(99011-02-6)的注意事项:

1. 需要经医生指导后使用。本品为外用药, 应避免与眼接触。

2. 治疗部位不需用绷带等覆盖。

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。

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。

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。

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

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/m²。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-咔唑-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](#)