



本PDF文件由 免费提供, 全部信息请点击[112887-68-0](https://www.ichemistry.cn), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](https://www.ichemistry.cn)

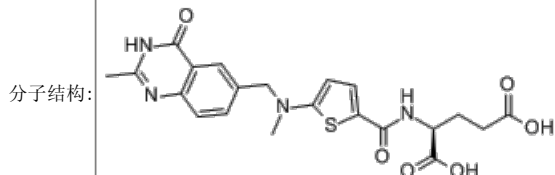
如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](https://www.ichemistry.cn)

CAS Number:112887-68-0 基本信息

中文名: 雷替曲塞

英文名: Raltitrexed

别名: (S)-2-[(1-{5-[Methyl-(2-methyl-4-oxo-3,4-dihydro-quinazolin-6-ylmethyl)-amino]-thiophen-2-yl}-methanoyl)-amino]-pentanedioic acid



分子式: $C_{21}H_{22}N_4O_6S$

分子量: 458.49

CAS登录号: 112887-68-0

物理化学性质

性质描述: 浅黄色或绿黄色结晶粉末

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。
S37/39: 使用合适的手套和防护眼镜或者面罩。

危险类别码: R36/38: 对眼睛和皮肤有刺激作用。

CAS#112887-68-0化学试剂供应商(点击生产商链接可查看价格)

大连美仑生物技术有限公司 专业从事112887-68-0及其他化工产品的生产销售 0411-82593631、82593920

将来试剂-打造最具性价比试剂品牌 雷替曲塞专业生产商、供应商, 技术力量雄厚 021-61552785

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. 112887-68-0](https://www.ichemistry.cn) 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: 晚期直肠、结肠癌的一线治疗

1. 雷替曲塞(112887-68-0)的制备方法:

2, 6-二甲基-4(3H)-喹唑啉酮(I)用叔戊酰氧基甲基氯进行N烷化后, 再用N-溴代丁二酰亚胺溴化, 得到6-(溴甲基)-2-甲基-3-[(叔戊酰氧基)甲基]-4(3H)-喹唑啉酮(III)。(III)和N-[5-氨基噻吩-2-羰基]-L-谷氨酸二乙酯(IV)缩合, 生成物V和氢氧化钠的乙醇水溶液在室温下搅拌水解, 并同时脱保护基, 然后酸化得到产物。

2. 制剂规格:

本品为白色冻干粉末, 每瓶含雷替曲塞2mg。

3. 雷替曲塞(112887-68-0)的药理毒理:

药理学研究表明, 雷替曲塞为新一代水溶性胸苷酸酶抑制剂, 该药通过细胞膜外还原型叶酸盐载体系统将本品主动摄入细胞内, 而后迅速代谢为多谷氨酸类化合物抑制胸苷酸酶的活性, 并能在细胞内滞留, 长时间发挥作用。它对结肠直肠癌细胞系的抑制作用强于5-氟尿嘧啶, 雷替曲塞的IC50长期给药为1.3~3.9 nmol/L, 短期给药为80 nmol/L, 而5-氟尿嘧啶与甲酰四氢叶酸合用长期给药IC50为330~5800 nmol/L, 短期给药为150000 nmol/L。体外研

生产方法及其他:

究观察到雷替曲塞与5-氟尿嘧啶联合用药有协同作用,这种作用依赖于给药方案和剂量。对176例晚期结肠直肠癌患者进行的II期临床试验,给予雷替曲塞3 mg/m²,每3周1次,有25.6%产生综合疗效,从治疗到病情进展平均时间为4.2周,存活期平均为11.2月。1300多例晚期结肠直肠癌患者的3项III期临床研究结果表明,雷替曲塞治疗组(每3周1次,每次3 mg/m²)与5-氟尿嘧啶加甲酰四氢叶酸治疗组(5-氟尿嘧啶425mg/m²加甲酰四氢叶酸20 mg/m²或5-氟尿嘧啶400 mg/m²加甲酰四氢叶酸200 mg/m²,每天1次,连续5天,每4~5周重复1次),所产生的客观有效率相似,分别为14.3%~19.3%和15.2%~18.1%,中位缓解时间分别为3.1~4.8和3.6~5.3个月,中位生存期分别为9.7~10.9和10.2~12.7个月。

4. 药动学:

患有不同程度实体瘤的患者给予本品3 mg/m²治疗后,药物浓度与时间呈三室模型,C_{max}的平均值为833 μg/L,AUC为1090 μg/L·h,分布相半衰期T_{1/2}为0.8~3 h,最终消除半衰期T_{1/2γ}为8.2~105 h,与给药剂量无关。雷替曲塞主要消除途径是以原型药物形式从肾脏排出,患有轻、中度肾功能不全的患者的T_{1/2}明显延长,AUC比正常肾功能患者增加2倍。

5. 适应症:

在患者无法接受联合化疗时,本品可单药用于治疗不适合5-Fu/亚叶酸钙的晚期直肠结肠癌患者。

6. 雷替曲塞(112887-68-0)的不良反应:

静脉滴注本品后常见副作用为血液毒性包括骨髓抑制,中性粒细胞减少、血小板减少等,胃肠道副作用最常见有恶心、呕吐、腹泻,食欲不振。较少见黏膜炎、口炎(包括口腔溃疡)、消化不良和便秘,一般患者耐受性良好,副作用发生率较低。造血系统可能与药物有关的不良反应为白细胞减少,特别是中性粒细胞减少,贫血和血小板减少,可单独或同时发生。肝脏常见AST和ALT的可逆性升高。心血管系统:有报道临床中患者出现心律和心功能异常,发生率分别为2.8%和1.8%。小于2%的患者可发生关节痛和张力过强(肌痉挛)等不良反应。皮疹较常见,发生率14%。较少见脱发、出汗、味觉异常和结膜炎。乏力和发热较常见

7. 相互作用:

未见本品与华法林、非甾体抗炎药的相互作用,建议本品不与亚叶酸钙、叶酸和维生素制剂联合用药,以免发生相互作用,与其他细胞毒药物联合用药的安全尚未确立。

8. 用法用量:

成人推荐给药剂量为每次3 mg/m²,用50至250 ml 0.9%生理盐水或5%葡萄糖稀释后静脉滴注15 min以上,每3周重复给药1次。避免与其它药物混合输注。

9. 药物过量:

药物服用过量的产生严重的骨髓抑制等血液毒性和胃肠道毒性,应避免使用过量或遵医嘱,药物过量时可每6 h给予亚叶酸钙25 mg/m²。

10. 雷替曲塞(112887-68-0)的注意事项:

对本品过敏者及有严重并发症者禁用。孕妇、治疗期间妊娠或哺乳期妇女禁用。使用本药钱排除妊娠可能。重度肾功能损害者禁用。

本品只做单独给药,避免与其它药物混合使用。本品用0.9%生理盐水或5%葡萄糖水溶液稀释后应避光保存,在24小时内使用。轻度和中毒肝损伤患者使用时无需调整本品剂量,但本品部分经粪便排泄,严重肝损伤患者使用时应注意。孕妇及哺乳期妇女禁用本品。儿童患者使用本品的安全性尚未确立,儿童慎用。

11. 老年患者用药:

药代动力学研究表明肾功能损伤的老年患者血浆清除率降低,可发生体内积蓄,应降低本品的剂量肌苷清除率在55~65 mL/min,应给予推荐剂量的75%,肌苷清除率在25~54 mL/min,应给予推荐剂量的50%,每4周重复给药1次。

相关化学品信息

[1191-31-7](#) [117238-60-5](#) [116523-57-0](#) [113518-49-3](#) [114232-60-9](#) [117-85-1](#) [119753-64-9](#) [114831-14-0](#) [112833-40-6](#) [110879-67-9](#) [114613-94-4](#) [油酸铜](#) [118872-62-1](#) [119911-60-3](#) [119322-27-9](#) 445

生成时间2016-10-27 10:28:19