

本PDF文件由



免费提供, 全部信息请点击[85622-93-1](#), 若要查询其它化学品请登录[CAS号查询网](#)

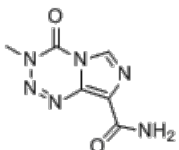
如果您觉得本站对您的学习工作有帮助, 请与您的朋友一起分享:) [爱化学www.ichemistry.cn](#)

CAS Number:85622-93-1 基本信息

中文名: 替莫唑胺;
4-甲基-5-氧代-
2,3,4,6,8-五氮杂双环
[4.3.0]壬-2,7,9-三烯-9-
甲酰胺;
3,4-二氢-3-甲基-4-氧代
咪唑

英文名: Temozolomide

别名: 4-Methyl-5-oxo-
2,3,4,6,8-
pentazabicyclo[4.3.0]
nona-2,7,9-triene-9-
carboxamide

分子式: 

$C_6H_6N_6O_2$

分子量: 194.15

CAS登录号: 85622-93-1

物理化学性质

性质描述: 本品为白色或浅粉色结晶粉末, 微溶于[水](#), 溶于热水。

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。
S36: 穿戴合适的防护服装。
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)。
S53: 避免暴露——使用前先阅读专门的说明。

	S24/25：防止皮肤和眼睛接触。 S36/37：穿戴合适的防护服和手套。	
危险类别码:	R22：吞咽有害。 R45：可能致癌。 R46：可能引起遗传基因损害。 R60：可能降低生殖能力。 R61：可能对未出生的婴儿导致伤害。 R36/37/38：对眼睛、呼吸道和皮肤有刺激作用。	
CAS#85622-93-1化学试剂供应商 (点击生产商链接可查看价格)		
	上海迈瑞尔化学技术有限公司 专业从事85622-93-1及其他化工产品的生产销售 0755-86170099 孝感深远化工有限公司 (医药中间体生产商) 替莫唑胺专业生产商、供应商，技术力量雄厚 0712-2580635 15527768836 大连美仑生物技术有限公司 长期供应4-甲基-5-氧代-2,3,4,6,8-五氮杂双环[4.3.0]壬-2,7,9-三烯-9-甲酰胺等化学试剂，欢迎垂询报价 0411-82593631、82593920	

湖北三元素 生物科技有 限公司 生产 销售3,4-二氢- 3-甲基-4-氧代 咪唑👉百灵威 科技有限公司 是以 C6H6N6O2为 主的化工企 业，实力雄厚 400-666-7788 🔥毕得医药科 技有限公司 本 公司长期提供 Temozolomide 等化工产品 4006-147-117 将来试剂-打造 最具性价比试 剂品牌 是4- Methyl-5-oxo- 2,3,4,6,8- pentazabicyclo [4.3.0]nona- 2,7,9-triene-9- carboxamide 等化学品的生 产制造商 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. 85622-93-1 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:	抗肿瘤药
	1. 替莫唑胺(85622-93-1)的制备方法： 5-氨基-4-甲酰胺基咪唑经亚硝酸重氮化后，再和异氰酸甲酯在二氯甲烷中反应，环合得到替莫唑胺。 2. 制剂规格： 本品有4种规格，分别为每粒胶囊含替莫唑胺5，20，100或250mg，药用墨

水印记，印记颜色依次为绿色、棕色、蓝色和黑色。琥珀色玻璃瓶装，各规格均有5粒和20粒装两种包装。 3. 药理毒理： 替莫唑胺用于治疗成人顽固性多形性成胶质细胞瘤，于1999年8月11日通过FDA批准，在美国上市。 替莫唑胺不直接发挥作用，在生理pH下，它经非酶途径快速转化为活性化合物MTIC [5-(3-甲基三氮烯-1-)咪唑-4-酰胺]。人们认为MTIC的细胞毒性主要源于其DNA烷基化(甲基化)作用，烷基化主要发生在鸟嘌呤的O6和N7位。 4. 替莫唑胺(85622-93-1)的毒理作用： 遗传毒性：替莫唑胺对体外细菌有致突变作用(Ames试验)，对哺乳细胞染色体有致裂变作用(人外周血清淋巴细胞试验)。生殖毒性：目前尚未进行替莫唑胺的生殖毒性研究，但大鼠和狗的重复给药毒性研究表明，大鼠和狗给药剂量分别为50mg/m²和125mg/m²(按体表面积计算，分别约相当于最大推荐人日用量的1/4和5/8)时，本品对动物睾丸有毒性，表现为合胞体细胞(即未成熟精子)出现和睾丸萎缩。致癌性：尚未进行替莫唑胺的常规致癌试验。给大鼠每隔28天连续5天给予替莫唑胺125mg/m²(按体表面积计算、与最大推荐人日用量相当)，给药3个周期后，雌性和雄性大鼠均产生乳腺癌。以25、50、125mg/m²(按体表面积计算，大约相当于最大推荐人日用量的1/8到1/2)给药6个周期后，所有剂量	
--	--

组动物均出现乳腺癌：高剂量组在心脏、眼、精囊、唾液腺、腹腔、子宫及前列腺等组织出现纤维肉瘤，还出现精囊癌、心脏神经鞘瘤、视神经癌、哈德氏腺癌，另外可见动物皮肤、肺、垂体、甲状腺等组织产生腺瘤。 5. 替莫唑胺 (85622-93-1) 的药动学： 口服给药后，本品快速而完全地吸收；血浆药物浓度于1 h内达峰。食物可减少其吸收速率和程度。本品消除迅速，平均半衰期为1.8h，在治疗剂量范围内呈线性动力学。平均表观分布容积为0.4 L.kg⁻¹。与人血浆蛋白微弱结合，平均结合百分数为15%。 在生理pH下，替莫唑胺自发水解为活性片段MTIC和替莫唑胺酸代谢物。MTIC进一步水解为5-氨基-咪唑-4-酰胺(AIC)和甲基胍，前者是嘌呤和核酸生物合成中的中间体，后者被认为是烷基化的活性片段。细胞色素P450在替莫唑胺和MTIC的代谢中仅起次要作用。与替莫唑胺的AUC相比，MTIC和AIC的暴露程度分别为2.4%和23%。给药后7 d，总放射性剂量的38%被回收；37.7%在尿中，0.8%在粪便中。尿中回收放射活度的大部分是原形替莫唑胺(5.6%)，AIC(12%)，替莫唑胺酸代谢物(2.3%)和未知极性代谢物(17%)。替莫唑胺的总体清除率约为5.5L.h⁻¹.m⁻²。 群体药物动力学分析提示，年龄对替莫唑胺的药物动力学无影响，妇女对本品的清除率(按体表面	
---	--

生产方法及其他:	积校正)比男性低5%，吸烟者与不吸烟者的口服清除率相近。种族对本品药物动力学的影响未研究。 群体药物动力学分析还表明，肌酐清除率在36~130 ml.min⁻¹.m⁻²范围内对本品口服给药后的清除率无影响。未对本品在重度肾功能不全患者(CL_{cr}<36ml.min⁻¹.m⁻²)的药物动力学进行研究。对重度肾功能不全患者给药时须谨慎。没有考察透析患者的用药情况。 替莫唑胺在轻中度肝损害患者的药物动力学与肝功能正常的患者相似。对重度肝损害患者给药时须谨慎。 儿科患者(3~17岁)与成年患者对替莫唑胺有相似的清除率和半衰期。对3岁以下儿童无用药经验。 6. 适应征： 患顽固性多形性成胶质细胞瘤的成年患者。 7. 替莫唑胺(85622-93-1)的不良反应： 本品主要的不良反应包括恶心、呕吐、倦怠和血液学反应。恶心、呕吐、头痛和倦怠的发生频率最高。这些不良反应通常为NCI通用毒性标准(NCI common toxicity criteria, CTC)1或2级(轻至中度)，且为自限性，用止吐药即可控制恶心和呕吐。重度恶心和呕吐(CTC3或4级)的发病率分别为10%和6%。 骨髓抑制(血小板减少症和中性粒细胞减少症)为剂量限制性不良反应。通常在治疗的第1个周期发生，不累积。女性患者4级中性粒细胞减少症(ANC<500个细胞/L)和4级血小板
----------	---

减少症(<2万个细胞/L)发生率比男性患者高(12%比5%和9%比3%);70岁以上患者4级血小板减少症发生率比70岁以下患者高(9.5%比5.5%),4级中性粒细胞减少症发生率相同(均为7%)。但就总体不良反应发生率而言,70岁及70岁以上患者的发生率并不更高。 8. 相互作用: 丙戊酸可使替莫唑胺的清除率降低约5%。雷尼替丁不会改变替莫唑胺和MTIC的c_{max}或AUC。同时给予地塞米松、普鲁^氢哌嗪、^苯妥英、卡马西平、奥丹亚龙、H₂受体拮抗剂或苯巴比妥,对口服替莫唑胺未见影响。 9. 用法用量: 本品剂量必须根据上一治疗周期的中性白细胞和血小板计数谷值和下一周期开始时的中性白细胞和血小板计数调整。以150 mg·m⁻²为起始剂量,28d为一治疗周期,在头5 d连续给予本品,每日一次。若在第29天即下一周期给药的第1天,绝对中性白细胞计数(ANC)谷值≥1.5×10⁹/L(1500/μl),血小板计数≥100×10⁹/L(10万/μl),应将本品剂量增至200mg·m⁻²·d⁻¹。在治疗第22天(第一次给药21d后)或该天的48 h内必须进行完整的血液计数,并且每周一次,直至ANC>1.5×10⁹/L(1500/μl),血小板计数>100×10⁹/L(10万/μl)。在ANC和血小板计数超过这些数值之前,不得开始下一周期治疗。如果在任一周期中,ANC低于1.0×10⁹/L(1000/μl)或血小板计数<50×10⁹/L(5万/μl),应推迟下一周期治疗。	
---	--

1), 下一周期的剂量应减少50 mg.m⁻², 但不得低于最低建议剂量100 mg.m⁻²。 在病情恶化前可持续本品的治疗。在临床试验中, 治疗最长可持续2年; 但最佳治疗持续时间未知。 10. 禁忌: 1、对本品及辅料过敏者禁用。 2、由于替莫唑胺与达卡巴嗪均代谢为MTIC, 对达卡巴嗪过敏者禁用。 11. 替莫唑胺(85622-93-1)的注意事项: 1. 对儿科患者的安全性和有效性尚未确定。 2. 对本品胶囊中任何成分有过敏反应史的患者禁用。同时本品还禁用于对达卡巴嗪(DTIC)有过敏反应史的患者, 因为这两种药物都代谢为MTIC。 3. 以妊娠的危险等级为D类。动物实验表明, 替莫唑胺可能引起胎儿伤害。如果在妊娠期间用药或在用药期间怀孕, 应告知对胎儿的伤害。建议育龄妇女在进行本品治疗期间避免怀孕。虽未知本品是否从乳汁中排泄, 授乳妇女在用药期间应停止哺乳。 4. 动物实验和体外实验表明, 本品有致癌、致畸和生殖毒性。治疗时必须注意。 5. 对重度肾功能不全的患者和70岁以上患者给药时, 应谨慎。 6. 不得咀嚼和打开胶囊。如果无意间打开或破坏了胶囊, 须对胶囊内容物万分小心, 避免吸入或与皮肤、粘膜接触。应避免让儿童和宠物接近本	
--	--

	品。 7. 药物过量时，需进行血液学检查。必要时应采取支持治疗措施。	
相关化学品信息		
850374-98-0 磷酸哌 喹 85830-77-9 85386-94- 3 854085-71-5 溴化 钴 855416-27-2 857207-74- 0 857985-31-0 85567-22- 2 858262-43-8 (GLU2)- TRH 鸟苷三磷酸锂 85490-53- 5 85277-11-8 85700-75- 0 三氟乙酸酐 愈创哌 特 854387-17-0 85237-51- 0 859305-40-1 [29H, 31H-酞 菁-C-磺酸根合(2-)- N29, N30, N31, N32]铜酸(1-)与氢 (Z)-9-十八烷基-1-胺的化合 物 850183-33-4 85410-00- 0 854719-69-0 850314-47- 5 857807-76-2 859304-84- 0 850349-80-3 852227-94- 2		

生成时间2016-3-4 18:06:44