

司他夫定StavudineCAS号3056-17-5斯他夫定

产品名称	司他夫定StavudineCAS号3056-17-5斯他夫定
公司名称	杭州柯莱生物医药科技有限公司
价格	.00/件
规格参数	CAS号:3056-17-5 分子式:C10H12N2O4 英文名:Stavudine
公司地址	浙江省杭州市上城区海运国际大厦1号楼1903室-12（自主申报）（注册地址）
联系电话	17357819709

产品详情

中文名称司他夫定中文同义词司他夫啉;司他味啉;斯他夫定;2',3'-二脱氢-3'-脱氧胸苷,核苷类似物,能抑制HIV逆转录酶;D4T.司他夫定(STAVUDINE);二乙酰氨基乙酸乙二胺(司他夫定);止血宝(新凝灵);司他夫定3056-17-5英文名称Stavudine英文同义词STAVUDINE;3'-deoxythymidin-2'-ene;3'-DEOXY-2Chemicalbook k',3'-DIDEHYDROTHYMIDINE;ZERIT;STAVUDINE[2'',3''-DIDEHYDRO-3''-DEOXYTHYMIDINE];NSC163661;Stavir;Thymidine,2'',3''-didehydro-3''-deoxy-CAS号3056-17-5分子式C10H12N2O4分子量224.21EINECS号641-374-0

概述随着艾滋病患者人数的不断增加，尤其近年来国内艾滋病感染病例的上升，艾滋病治疗药物的研究和开发不仅国际上倍受关注，而且也越来越受到国内医药界的重视.艾滋病治疗药物中，核苷类似物或衍生物是目前临床广泛使用的药物.我们在前期一些新型氮杂核苷类似物设计合成的基础上，对一些临床使用的核苷类似物进行合成工艺的探索.司他夫定是由美国BMS公司开Chemicalbook发上市的核苷结构的治疗艾滋病药物，具有RNA指导的DNA聚合酶抑制作用，是抑制HIV逆转录酶的抗病毒药。药理作用本品是一种与胸苷相关的核苷逆转录酶抑制剂。在细胞内分阶段转化成三磷酸盐，此盐可终止逆转录病毒的DNA合成(包括HIV)。此种终止作用是通过逆转录酶的竞争性抑制并结合进入病毒DNA中完成的。对包括HIV在内的逆转录病毒具有活性。

1)5-甲基-2, 4-二(三甲基硅氧基)嘧啶(2)胸腺嘧啶(25.0g, 198mmol), 六甲基二硅烷胺(120mL), 二甲基甲酰胺(5mL)混合, 搅拌, 加热回流至溶液变澄清, 约3h, 常压蒸去大部分未反应的六甲基二硅烷胺, 减压蒸馏, 收集馏份127.0129.0 /18mmHg, 得到无色透明的液体(50.8g,), 收率95%.2)5-甲基-2', 3', 5'-三乙酰基尿苷(3)四乙酰核糖(45.0g, 141mmol)溶于二氯乙烷(150mL), 氮气保护下, 加入5-甲基-2, 4-二(三甲基硅氧基)嘧啶(42.0g, 155mmol), 冰盐浴冷却至0 , 搅拌下滴加无水四氯化锡(40.5g, 155mmol)二氯乙烷(50mL)溶液, 加毕, 自然升至室温, 搅拌反应12h.搅拌下加入饱和碳酸氢钠水溶液(400mL), 分去水层

, 水洗, 无水硫酸钠干燥, 过滤, 蒸去溶剂. 得到产品56.0g, 收率98%。3) 5-甲基尿苷(4) 5-甲基-2', 3', 5'-三乙酰基尿苷(56.0g, 13Chemicalbook8mmol)溶于饱和氨甲醇溶液(140mL), 室温搅拌反应, TLC跟踪, 反应结束后, 蒸去溶剂, 精制后得到5-甲基尿苷31.0g, 收率84%. 熔点: 180.0181.0。4) 5-甲基-2', 3', 5'-三甲磺酰尿苷(5) 5-甲基尿苷(12.8g, 50mmol)溶于吡啶(75mL), 冰浴冷却, 搅拌下滴加甲磺酰氯(17.4mL, 152mmol). 加毕, 保温搅拌反应至薄层层析显示反应结束. 将反应液倒入搅拌的冰水(500g)中析出灰白色固体, 继续搅拌5min过滤, 水洗. 蒸干溶剂, 得到淡黄色固体22.4g, 收率91%。5) 5-甲基-3'-甲磺酰-5'-苯甲酰-2, 2'-环尿苷(6) 5-甲基-2', 3', 5'-三甲磺酰尿苷(22.4g, 45.4mmol), 苯甲酸钠(22.6g, 157mmol), 乙酰胺(130.0g)混合, 搅拌, 加热至115, 保温1.5h. 反应液倒入搅拌的1200g冰水中, 析出白色固体, 抽滤, 水洗2次, 每次50mL, 干燥得到产品16.1g, 收率84%。

用途 抗病毒药。其生物利用度较高, 有望改善抗HIV感染的现状。