

恩曲他滨CAS号143491-57-0依曲西他滨恩去他滨柯莱生物原料

产品名称	恩曲他滨CAS号143491-57-0依曲西他滨恩去他滨柯莱生物原料
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:143491-57-0 分子式:C ₈ H ₁₀ FN ₃ O ₃ S 英文名:Emtricitabine
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

中文名称恩曲他滨中文同义词恩曲他滨;5-氟-1-(2R,5S)-[2-羟甲基-1,3-氧硫环-5-酰]胞嘧啶;恩曲他滨(5-氟-1-(2R,5S)-[2-羟甲基-1,3-氧硫环-5-酰]胞嘧啶);恩曲他滨(标准品);恩去他滨;恩曲他滨企标98.0+%;依曲西他滨;ABCG2/BRCP抑制剂(FUMITREMORGINC)英文名称Emtricitabine英文同义词Emtricitabine(200mg);4-amino-5-fluoro-1-[(2R,5S)-2-(hydroxymethyl)-1,3-oxathiolan-5-yl]-1,2-dihydropyrimidin-2-one;EMtricitabine(EMtriva);4-Amino-5-fluoro-1-[(2R,5S)-2-hydroxymethyl]-1,3-oxathiolan-5-yl]-2-(1H-pyrimidinone,(-)-FTC,Chemicalbook(-)-b-23Dideoxy-5-fluoro-3thiacytidine,524W91,BW-52491,Coviracil,;Entricitabine;2(1H)-Pyrimidinone,4-amino-5-fluoro-1-(2R,5S)-2-(hydroxymethyl)-1,3-oxathiolan-5-yl;-2'-deoxy-5-fluoro-3'-thiacytidine;4-Amino-5-fluoro-1-[(2R,5S)-2-hydroxymethyl]-1,3-oxathiolan-5-yl]-2-(1H-pyrimidinone,(-)-FTC,(-)--2',3'-Dideoxy-5-fluoro-3'-thiacytidine,524W91,BW-52491,CoviracilCAS号143491-57-0分子式C₈H₁₀FN₃O₃S分子量247.25EINECS号604-363-1

抗病毒活性药恩曲他滨(emtricitabine, FTC)为一种新型的核苷类逆转录酶抑制剂,其化学结构与目前临床上广泛使用的其他核苷类似物不同之处在于其5-碳位置上的氟基,作用机制类似于拉米夫定(lamivudine, 3TC),较拉米夫定血浆半衰期更长,抗病毒活性更好。Chemicalbook药理作用恩曲他滨为化学合成类核苷胞嘧啶,其抗HIV-1的机制是通过多步磷酸化形成具有细胞活性5'-三磷酸盐,5'-三磷酸盐通过与天然的5-磷酸胞嘧啶竞争性地渗入到病毒DNA合成的过程中,最终导致其DNA链断裂,从而竞争性地抑制HIV-1逆转录酶和HBV-DNA聚合酶活性。

新型抗HIV药物恩曲他滨是由美国GileadSciences公司研制成功的一种新型核苷类逆转录酶抑制剂,属抗病毒类药物,对HIV-1、HIV-2及HBV均有抗病毒活性,抗病毒活性表现在它特异性地抗HIV-1、HIV-2和HBV,而其药浓升至100nmol/L,亦未见它对HSV-1、HSV-2、HCMV、VZV、corona、黄热病病毒、呼吸

道合胞体病毒、Rota、流感病毒或鼻病毒表现出活性。即使是低于微摩尔浓度，该药也显现出对HIV1的LAV和 B病毒株及HIV-2的ROD2和ZY病毒株的强效抑制作用，其IC50值比AZT(齐多夫定)低95倍。新型抗HIV药物是否会对AZT等其他抗病毒药耐药病毒株产生交叉耐药性，已日益成为评估新药的焦点。恩曲他滨对AZT耐药病毒株的交叉耐药性试验表明，尽管对这些耐药株的IC50值略有提高，所有病毒株仍对恩曲他滨相对敏感。而恩曲他滨耐药病毒株则会明显对抗病毒药3TC(拉米夫定)产生交叉耐药性，但对AZT仍然敏感。研究显示，该药可与AZT联用并具协同作用。恩Chemicalbook曲他滨在产生HBV的细胞系HepG2.2.15(PSA亚种)中表现出极强的抗病毒活性，它可剂量依赖性地降低胞外及胞内HBVDNA数量，其IC50值为10nmol/L，该值可与另一HBV复制抑制剂3TC相比拟。干扰素 α 1(Welferon)、 $2a$ (Roferon)、 $2b$ (IntronA)均能抑制HBV病毒颗粒的产生以及在慢性生产细胞中胞内复制型病毒的积聚，它们与恩曲他滨联用可产生协同作用。通过在一种嵌合性小鼠模型中的抗HBV作用及在自然受感染的土拨鼠中的抗土拨鼠肝炎病毒(WHV)作用，考察了恩曲他滨的体内抗肝炎活性。在该小鼠模型中，以不同剂量给具免疫缺陷并带有可产生人HBV的人源性肿瘤的小鼠口服该药，通过抗体捕获/PcR实验发现，血液HBVDNA(Dane颗粒)呈剂量依赖性减少，即使低剂量3.5mg/(kg·d)也会产生明显的抑制作用，同时胞内复制的HBVDNA水平也呈剂量依赖性减少，然而，在最大剂量下(89mg/(kg·d))肿瘤大小仍无变化，这表明该药抗HBV活性具选择性。

药理作用恩曲他滨为化学合成类核苷胞嘧啶。其抗HIV-1的机制是通过体内多步磷酸化，形成活性三磷酸酯竞争性地抑制HIV-1逆转录酶，同时通过与天然的5-磷酸胞嘧啶竞争性地渗入到病毒DNA合成的过程中，最终导致其DNA链合成中断。其抗HBV的机制是由于HBV复制过程含有恩曲他滨的作用靶点，即逆转录过程。对哺乳动物DNA聚合酶 α 、 β 和线粒体DNA聚合酶抑制活性弱。体外抗病毒活性：体外进行的实验室和临床抗HIV病毒株有淋巴母细胞系、MAGI-CCR5细胞系和Chemicalbook周围血单核细胞中评估。50%抑制浓度(IC50)值范围是0.0013 ~ 0.158 μ g/mL。在与核苷类反转录酶抑制剂(NRTI)、非核苷类反转录酶抑制剂(NNRTI)和蛋白酶抑制剂(PI)联用的研究中，显示有药物协同作用。多数的合并用药临床研究还未进行。体外试验显示对HIV-1中A、C、D、E、F和G亚型有抗病毒活性(IC50值范围是0.007 ~ 0.075 μ g/mL)，对HIV-2型显示有种属特异的抑制活性(IC50值范围是0.007 ~ 1.5 μ g/mL)。

适应证1.恩曲他滨与其他抗病毒药物合用于成人HIV-1感染的治疗。患者为未经过逆转录酶抑制剂治疗和经过逆转录酶抑制剂治疗病毒已被抑制者。2.用于慢性乙型肝炎治疗。不良反应临床应用中，接受恩曲他滨和其他抗病毒药物治疗，最常见的不良反应有头痛、腹泻、恶心和皮疹，程度从轻到中等严重。约1%病人因以上原因中止服药。所有不良反应发生频率与对照组相当，但皮肤色素沉着在恩曲他滨组略高。皮肤色素沉着以出现于手掌和/或足底明显，一般较轻，且不伴其他症状。其临床Chemicalbook意义及机制尚不明确。注意事项本品主要经肾脏排泄，故肾功能不全患者服用本品应减量。孕妇服用恩曲他滨可能对胎儿和新生儿有不利影响。本品通过乳腺分泌也可影响到受乳婴儿。故除考虑挽救母亲生命，一般不推荐孕妇和哺乳期妇女使用本品。儿童尚未建立安全有效的依据。故儿童不推荐使用。老年人在选择剂量时应谨慎。可根据其肝、肾、心脏功能的衰退、伴发的疾病以及其也药物治疗的影响，酌情减量服用。药物过量的影响尚未知，如果出现药物过量，应进行监护。必要时应用维持剂量治疗。

用途恩曲他滨治疗慢性乙肝，有较强的抗病毒作用，安全性、耐受性良好。恩曲他滨替诺福韦是目前艾滋病抗病毒治疗方Chemicalbook案中的骨干药物，也是国内外quanwei指南针对成人HIV暴露前预防(PrEP)和暴露后预防(PEP)的首个推荐用药。