

恩杂鲁胺EnzalutamideCAS号915087-33-1柯莱生物研发研究机构zhuangong

产品名称	恩杂鲁胺EnzalutamideCAS号915087-33-1柯莱生物研发研究机构zhuangong
公司名称	杭州柯莱生物医药科技有限公司
价格	3452.00/件
规格参数	CAS号:915087-33-1 分子式:000 英文名:000
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

中文名称恩杂鲁胺中文同义词恩扎鲁胺;4-[3-[4-氰基-3-(三氟甲基)苯基]-5,5-二甲基-4-氧代-2-硫酮-1-咪唑烷基]-2-氟-N-甲基苯甲酰胺(恩扎鲁胺);4-(3-(4-氰基-3-(三氟甲基)苯基)-5,5-二甲基-4-氧代-2-硫代咪唑啉-1-基)-2-氟-N-甲基苯甲酰胺;恩杂鲁胺(ENZALUTAMIDE);4Chemicalbook-(3-(4-氰基-3-(三氟甲基)苯基)-5,5-二甲基-4-氧代-2-硫代氧代咪唑烷-1-基)-2-氟-N-甲基苯甲酰胺;MDV3100,恩杂鲁胺;4-(3-(4-氰基-3-(三氟甲基)苯基)-5,5-二甲基-4-氧代-2-硫氧代咪唑啉-1-基)-2-氟-N-甲基苯甲酰胺;恩杂鲁胺(MDV3100)英文名称Enzalutamide

理化性质白色或灰白色的非吸湿性结晶固体，熔点为195-196，易溶于DMSO和乙腈，微溶于无水乙醇，难溶于水。药理作用恩杂鲁胺（XTANDI、enzalutamide）属于口服类雄激素受体拮抗剂，目前经临床研究及美国FDA（食品与药品监督局）批准，用于化疗后进展的转移性去势耐受前列腺癌的治疗（即前列腺癌患者经化疗后，肿瘤或癌症细胞仍然在生长的此类患者），可延长患者生存期。前列腺癌在美国的发病率很高，每年新增近24万患者（所有癌症中最高），每年死亡近3万人（仅次于肺癌、乳腺癌、结直肠癌），中国发病率偏低。恩杂鲁胺是一种雄激素受体抑制剂，作用靶点不同于2010年批准的卡巴他赛和2011年批准的Chemicalbook阿比特龙，能够竞争性地抑制雄激素与受体的结合，并且能抑制雄激素受体的核转运以及该受体与DNA的相互作用，体外实验研究显示，恩杂鲁胺能够抑制前列腺癌细胞的增殖并诱导其死亡，在小鼠前列腺癌异种移植的模型实验中恩杂鲁胺能够缩小肿瘤体积恩杂鲁胺的主要代谢物为N-去甲基恩杂鲁胺，其在体外表现出与恩杂鲁胺相似的抑制活性该药推荐的成人剂量为每日160mg，服药后迅速吸收，血浆浓度在0.5~3h内达到最高水平，平均末端半衰期为5.8d，主要代谢酶为CYP2C8和CYP3A4该药应避免与强CYP2C8抑制剂(如吉非贝齐，gemfibrozil)联合使用，如需要共同给药，应减少恩杂鲁胺剂量至80mg，每天1次。

适应症用于治疗已扩散或复发的晚期男性去势耐受前列腺癌。