

依维莫司CAS号159351-69-6依维莫司原料药Everolimus柯莱生物原料API

产品名称	依维莫司CAS号159351-69-6依维莫司原料药Everolimus柯莱生物原料API
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:159351-69-6 分子式:C53H83NO14 英文名:Everolimus
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

中文名称依维莫司中文同义词依维莫司溶液;依维莫司原料药;依维莫斯;依维莫司1G;依维莫司(2.0%BHT);依维莫司(不含BHT);EVEROLIMUS依维莫司;依维莫司英文名称Everolimus英文同义词Everolimus (mixture of isomers) ;Everolimus powder;CERTICA Chemicalbook N;ZORTRESS;AFINITOR;Rapamycin, 42-O-(2-hydroxyethyl)-;Everolimus;Certican;CERTICAN(R);Everolimus(RAD-001)CAS号159351-69-6分子式C53H83NO14分子量958.22EINECS号621-003-9

西罗莫司衍生物依维莫司是西罗莫司的衍生物，又称40-O-(2-羟乙基)-雷帕霉素，或40-O-(2-羟乙基)-西罗莫司，属于干扰细胞通讯防止肿瘤细胞生长的激酶类药物，是一种口服哺乳动物雷帕霉素(mTOR)抑制剂，以往临床Chemicalbook上主要用来预防肾移植和心脏移植手术后的排斥反应。目前也可用于治疗已使用过两种抑制血管内皮生长因子受体激酶抑制剂：舒尼替尼（Sutent,辉瑞制药）和索拉非尼（Nexavar,拜耳制药）的晚期肾癌患者，而且毒副作用较轻微。

舒尼替尼和索拉非尼是多种激酶抑制剂（作用于多种细胞靶位），而依维莫司则阻断哺乳动物雷帕霉素靶（mTOR）的专一蛋白质，干扰癌症细胞的生长、分化和代谢。此mTOR途径在一些人肿瘤内调节异常。依维莫司与细胞内蛋白质FKBP-12结合，形成抑制络合物，从而抑制mTOR激酶活性，同时降低mTOR的下游效应物S6核糖体Chemicalbook蛋白激酶（S6K1）和真核延伸因子4E结合蛋白（4E-BP）的活性。此外依维莫司抑制低氧诱导因子（如HIF-1）的表达和降低血管内皮生长因子（VEGF）的表达，体内外研究均显示可降低细胞增生、血管生成和葡萄糖摄取。备注：1，mTOR是一种丝氨酸-

苏氨酸激酶，P13K/AKT的下游产物。2，西罗莫司又称雷帕霉素。

用途依维莫司大环内酯类免疫抑制剂；依维莫司是雷帕霉素的衍生物。依维莫司抑制细胞因子介导的淋巴细胞增殖。

作用机制依维莫司可与胞内蛋白FKBP12结合形成抑制性的复合体mTORC1，该复合体可抑制mTOR的活性。mTOR信号通路的抑制可导致转录调节因子S6核糖体蛋白激酶（S6K1）和真核生物延伸因子4E结合蛋白（4E-BP）的活性降低，从而干扰细胞周期、血管新生、糖酵解等相关蛋白的翻译和合成。此外，依维莫司还具有一定的抗肿瘤功效，可在体内外抑制实体瘤的糖酵解。

治疗晚期肾癌肾癌占癌症的2~3%，肾癌早期以外科手术为主，晚期则以化疗为主，对化疗和放疗反应往往欠佳，其实，单独使用白介素2或联合阿尔法干扰素有关的免疫疗法由于其毒性及普遍较差的治疗反应使其在临床使用受限。肾细胞癌是最常见的肾癌类型，病发于肾小管上皮细胞。通常，这类患者体内的癌细胞对放疗和化疗等标准疗法会产生抵抗性，从而使大多数人通过肾脏摘除达到治疗目的。若患者的癌变部位jinxian定在肾脏，60-70%的人生存期可达到5年，但癌细胞一旦发生转移，则患者生存期将会大幅降低。2009年3月30日，诺华公司原免疫抑制药物依维莫司（everolimus，AfChemicalbookinitor）用于肾癌获得美国FDA批准。研究结果显示，依维莫司可明显增加癌症病人的无进展生存期，对于经舒尼替尼或索拉非尼治疗无效的晚期肾细胞癌病人，依维莫司提供了一个新的治疗选择。2009年8月，欧盟委员会已批准诺华生产的Afinitor(依维莫司)片剂用于晚期肾细胞癌(RCC)患者的治疗，欧洲医学肿瘤学会、欧洲泌尿学会（EAU）、西班牙肿瘤泌尿生殖小组（SOGUG）、欧洲癌症研究和治疗组织（EORTC）、欧洲医学肿瘤学会（ESMO）的治疗指南以及英国共识性指南等欧洲几项quanwei治疗指南进行更新，推荐Afinitor作为晚期肾癌患者的二线治疗药。