

# 劳拉替尼CAS号1454846-35-5PF0643922罗拉替尼洛拉替尼原料药API

产品名称	劳拉替尼CAS号1454846-35-5PF0643922罗拉替尼洛拉替尼原料药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:1454846-35-5 分子式:C <sub>21</sub> H <sub>19</sub> FN <sub>6</sub> O <sub>2</sub> 英文名:Lorlatinib
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

劳拉替尼中文同义词劳拉替尼(PF0643922);劳拉替尼3922;劳拉替尼;洛拉替尼;PF3922/劳拉替尼Chemicalbook;劳拉替尼劳拉替尼;洛拉替尼杂质(PF06463922);罗拉替尼英文名称Lorlatinib(PF-06463922)

简介劳拉替尼(PF-06463922)是美国辉瑞(Pfizer)公司通过对克唑替尼(Crizotinib)改造的ALK抑制剂，该药物2014年进入临床试验，用Chemicalbook于肺癌的治疗，主要针对第一代ALK抑制剂克唑替尼耐药和第二代ALK抑制剂色瑞替尼(Ceritinib)和艾乐替尼(Alectinib)耐药的、非小细胞肺癌患者。

适应症2017年4月27日，辉瑞公司宣布其新一代ALK/ROS1抑制剂劳拉替尼被FDA授予突破性药物资格，用于既往接受过一种或多种ALK抑制剂治疗，治疗后疾病进展的、ALK阳性、转移性NSCLC。

药理作用劳拉替尼是一种ALK抑制剂。ALK是一种受体酪氨酸激酶，属于胰岛素受体超家族，与白细胞酪氨酸激酶具有高度同源性。1994年，ALK首次以NPM1-ALK融合基因的形式在间变性大细胞淋巴瘤（large-celllymphoma，ALCL）中被发现。ALK基因位于人类染色体2p23，编码1620个氨基酸的多肽，经过翻译后修饰，生成200~220kDa的成熟ALK蛋白。ALK由1030个氨基酸组成的胞外配体结合域、跨膜域及胞内酪氨酸激酶结构域组成。ALK在各个物种中均高度保守，在成人脑中表达的ALK被认为在神经系统的发育和功能中Chemicalbook扮演重要角色ALK在小肠、睾丸、前列腺及结肠中也有表达，但其在正常淋巴组织、肺及其他组织中不表达。ALK可激活多个细胞内信号通路，包括磷脂酶C，JAK激酶、信号转导和转录激活因子（signaltransducerandactivatoroftranscription-3，STAT3）、磷脂酰肌醇-3-激酶（phosp

phosphatidylinositol3-kinase, PI3K)、哺乳动物雷帕霉素靶蛋白(mammalian target of rapamycin, mTOR)及丝裂原活化蛋白激酶(MAPK)等,参与调节细胞生长、转化及抗细胞凋亡。

用途 劳拉替尼应该算是第三代ALK抑制剂,可抑制克唑替尼耐药的9种突变,具有较强的血脑屏障透过能力,入脑效果较强,特别适合对其他ALK耐药的晚期NSCLC患者。劳拉替尼携带EGFR敏感突变的晚期非小细胞肺癌,可以接受众多EGFR抑制剂治疗,比如第一代药物易瑞沙、特罗凯、凯美纳,第二代药物阿法替尼、达克替尼,第三代药物奥西替尼(AZD9291)——这些靶向药的有效率高达70%甚至更高,副作用也不大,是这类患者的治疗shouxuan。

晚期非小细胞肺癌治疗药物 携带EGFR敏感突变的晚期非小细胞肺癌,可以接受众多EGFR抑制剂治疗,比如第一代药物易瑞沙、特罗凯、凯美纳,第二代药物阿法替尼、达克替尼,第三代药物奥西替尼(AZD9291)——这些靶向药的有效率高达70%甚至更高,副作用也不大,是这类患者的治疗shouxuan。同理,携带ALK融合突变、ROS-1融合突变的晚期非小细胞肺癌、间变大B细胞淋巴瘤、小部分胶质瘤、小部分肉瘤患者,可以接受众多的ALK抑制剂治疗,比如第一代药物克唑替尼,第二代药物色瑞替尼、艾乐替尼、布加替尼(AP26113),第三代药物劳拉替尼等——这些靶向药的有效率高达80%甚至更高,副作用也不大,是这类Chemicalbook患者的治疗shouxuan。2017年4月27日辉瑞宣布,FDA授予其新一代ALK/ROS1酪氨酸激酶抑制剂Lorlatinib“突破性药物”的称号,用于二线治疗ALK(间变性淋巴瘤激酶)阳性的转移性非小细胞肺癌(NSCLC)。辉瑞全球产品开发部,医学博士梅斯罗斯伯格说道:“这项研究证实了Lorlatinib对于治疗ALK阳性且治疗后进展的非小细胞癌NSCLC患者存在非凡潜力,为癌症患者提供了一个重要的治疗选择。辉瑞对于Lorlatinib的快速研发也体现其致力于靶向治疗,极大地满足患者的需求。我们期待与FDA加速审批这种疗法。”FDA此次的认定是基于lorlatinib的I/II期研究数据。