

# 苹果酸卡博替尼Cabozantinib

MalateCAS号1140909-48-3原料药API柯莱生物

产品名称	苹果酸卡博替尼Cabozantinib MalateCAS号1140909-48-3原料药API柯莱生物
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:1140909-48-3 分子式:C32H30FN3O10 英文名: Cabozantinib Malate
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

中文名称苹果酸卡博替尼中文同义词卡博替尼苹果酸盐; CABOZANTINIB(S)-苹果酸盐; N-[4-[(6,7-二甲氧基-4-喹啉基)氧基]苯基]-N'-(4-氟苯基)-1,1-Chemicalbook环丙烷二甲酰胺(S)-苹果酸盐; 卡博替尼苹果酸盐、XL-184; XL-184(苹果酸盐); 卡博替尼盐; 苹果酸卡博替尼; L-苹果酸卡博替尼英文名称 Cabozantinib Malate

用途苹果酸卡博替尼是一种小分子C-Met调节剂。苹果酸卡博替尼可作为有效的多靶标VEGFR2, Met, FLT3, Tie2, Kit和Ret抑制剂, 对VEGFR2, Met, FLT3, Tie2和Kit的IC50分别为0.035、1.8、14.4、14.3和4.6nM。苹果酸卡博替尼显示剂量依赖性抑制肿瘤生长和肿瘤消退, 与肿瘤脉管系统的破坏和广泛的肿瘤细胞凋亡有关。作用卡博替尼苹果酸盐由美国Exelixis生物制药公司研发。主要以与前列Chemicalbook腺癌增长与扩散有关的MET和VEGFR2酪氨酸激酶为靶点, 抑制肿瘤的转移和血管生成。合成以2-氨基-4,5-二甲氧基苯甲酸甲酯做原料, 依次经环化、氯化制得4-氯-6,7-二甲氧基喹啉, 再与对氨基苯酚经亲核取代反应得6,7-二甲氧基-4-(4-氨基苯氧基)喹啉(5)(或先与对硝基苯酚反应, 再经钯炭还原得5), 5与环丙烷-1,1-二羧酸缩合后, 再与对氟苯胺反应制得卡博替尼, 最后与(S)-苹果酸(8)成盐即得1, 总收率较低(<20%)

药理作用苹果酸卡博替尼(CabozantinibS-MALATE)原名XL184, 由美国Exelixis生物制药公司研发。主要以与前列腺癌增长与扩散有关的MET和VEGFR2酪氨酸激酶为靶点, 抑制肿瘤的转移和血管生成。苹果酸卡博替尼是Cabozantinib的苹果酸盐, 是有效的VEGFR2抑制剂, IC50为0.035nM, 也抑制c-Met, Ret, Kit, Flt-1/3/4, Tie2和AXL, IC50分别为1.3nM, 4nM, 4.6nM, 12nM/11.3nM/6nM, 14.3nM和7nM。