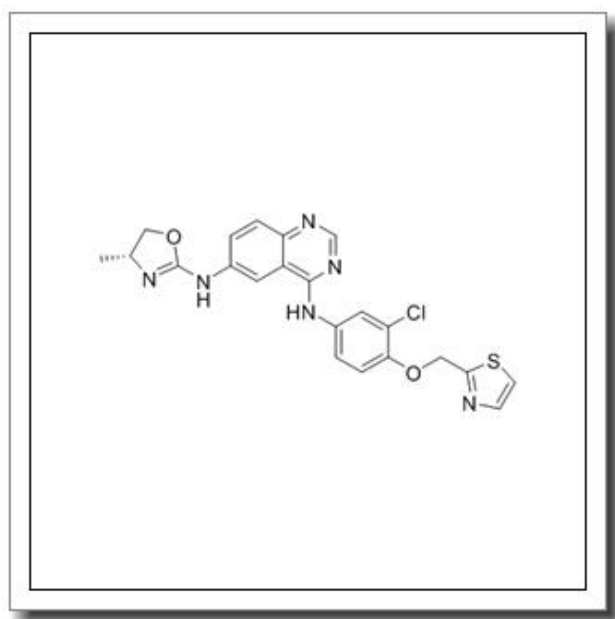


Varlitinib

4-N-[3-chloro-4-(1,3-thiazol-2-ylmethoxy)phenyl]-6-N-[(4R)-4-methyl-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-yl]quinazoline-4,6-diamine



产品基本信息

属性	值
化学名称	4-N-[3-chloro-4-(1,3-thiazol-2-ylmethoxy)phenyl]-6-N-[(4R)-4-methyl-4,5-dihydro-1,3-oxazol-2-yl]quinazoline-4,6-diamine
中文名称	Varlitinib
CAS 号	845272-21-1
分子式	C ₂₂ H ₁₉ C ₁ N ₆ O ₂ S
分子量	466.943
纯度	≥96%

产品说明

1. 产品概述与化学特性

Varlitinib (化学名称: 4-N-[3-氯-4-(1,3-噻唑-2-基甲氧基)苯基]-6-N-[(4R)-4-甲基-4,5-二氢-1,3-噁唑-2-基]喹唑啉-4,6-二胺) 是一种小分子激酶抑制剂, CAS 号为 845272-21-1, 分子式为 C₂₂H₁₉C₁N₆O₂S, 分子量为 466.943。该化合物以白色至类白色固体形式存在, 纯度 ≥96%, 具有明确的立体化学结构 (R 构型)。其化学结构中包含喹唑啉母核、噻唑环和噁唑啉环, 赋予其独特的生物活性与选择性。

2. 生物化学功能与重要性

Varlitinib 是一种高效、可逆的酪氨酸激酶抑制剂, 主要靶向 HER1 (EGFR)、HER2 和 HER4 受体, 通过竞争性结合 ATP 位点阻断下游信号通路 (如 PI3K/AKT 和 MAPK/ERK), 从而抑制肿瘤细胞增殖与转移。其独特的设计使其对 HER2 过表达型癌症 (如胃癌、乳腺癌) 表现出显著活性, 同时对部分耐药突变株 (如 T790M) 也具有一定抑制作用, 在靶向治疗领域具有重要研究价值。

3. 主要应用领域与具体用途

该化合物广泛应用于肿瘤学基础研究与药物开发领域:

- 体外研究: 用于细胞增殖抑制实验、激酶活性检测及信号通路机制研究
- 体内研究: 在异种移植瘤模型 (如胃癌 PDX 模型) 中评估抗肿瘤疗效
- 联合用药研究: 与化疗药物或免疫检查点抑制剂联用探索协同效应
- 临床前药代动力学研究: 评估吸收、分布、代谢特性

4. 储存条件与使用建议

储存条件: 建议避光保存于 -20℃ 干燥环境中, 长期储存需充惰性气体保护。开封后需密封防潮, 避免反复冻融。

使用建议:

- 溶解性: 推荐使用 DMSO 配制母液 (溶解度约 30 mg/mL), 工作浓度需根据实验体系优化 (通常为 0.1-10 μM)

- 处理注意事项：操作时需佩戴防护装备，避免直接接触皮肤或吸入粉尘
- 稳定性：溶液状态在-20℃下可保存 1 个月，建议现配现用

5. 质量控制与安全信息

质量控制：通过 HPLC 验证纯度 ($\geq 96\%$)，质谱与核磁共振确认结构，残留溶剂符合 ICH 标准。

安全信息：

- 危险标识：H302（吞咽有害）、H315（皮肤刺激）、H319（眼刺激）
- 应急处理：接触皮肤时立即用肥皂水冲洗，眼部接触需用生理盐水冲洗 15 分钟
- 废弃物处置：按危险化学品规范处理，不可直接排入下水道

（注：本产品仅限科研用途，不可用于人体或临床治疗。）