

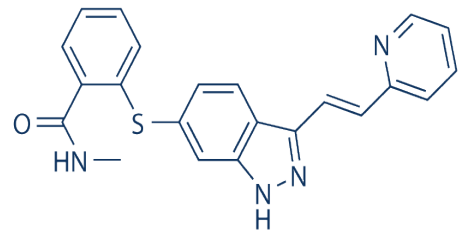
Axitinib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0137-10mM	Axitinib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0137-5mg	Axitinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SC0137-25mg	Axitinib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-methyl-2-[[3-[(E)-2-pyridin-2-ylethenyl]-1H-indazol-6-yl]sulfonyl]benzamide
简称	Axitinib
别名	AG013736, AG-013736, AG 013736, Inlyta
中文名	阿西替尼
化学式	C ₂₂ H ₁₈ N ₄ OS
分子量	386.47
CAS号	319460-85-0
纯度	99.9%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 35mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.29ml DMSO, 或每3.86mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0137-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Axitinib是一种多靶点抑制剂, 作用于VEGFR1、VEGFR2、VEGFR3、PDGFRβ和c-Kit, 在猪主动脉内皮细胞中IC50分别为0.1nM、0.2nM、0.1-0.3nM、1.6nM和1.7nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR1/FLT1	VEGFR2/Flk1	VEGFR2/KDR	VEGFR3	PDGFRβ
IC50	0.1nM	0.18nM	0.2nM	0.1nM-0.3nM	1.6nM
体外研究	Axitinib是受体激酶抑制剂, 作用于VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3、PDGFR-β和c-KIT时IC50分别为0.1、0.2、0.1-0.3、1.6和1.7nM。Axitinib可以阻断VEGFR的自磷酸化作用, VEGF调节的内皮细胞活力、微管形成及下游信号。Axitinib抑制多种细胞系的增殖, 如作用于IGR-N91、IGR-NB8、SH-SY5Y、无VEGF刺激的HUVEC时IC50分别为>1000nM、849nM、274nM和573nM。				
体内研究	Axitinib抑制常位移植模型, 如M24met(黑色素瘤)、HCT-116(结肠直肠癌)和SN12C(肾细胞癌)。活体研究显示, 按动物体重, 每千克口服处理30mg Axitinib, 与没有Axitinib处理的对照组相比, 实验组推迟肿瘤生长达到11.4天, 且用于IGR-N91侧腹移植瘤时, 与对照组(密度为49)相比实验组(密度降为21)降低血管密度。Axitinib在多种肿瘤包括肾细胞癌、甲状腺癌、非小细胞肺癌、黑色素瘤中显示出单一药效活性。				
临床实验	N/A				
特征	Axitinib与目前使用的sorafenib相比, 作为二代治疗法, 更有效。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	生成过量表达全长VEGFR-2、PDGFR-β和KIT的PAE细胞以及过量表达鼠VEGFR-2(Flk-1)或PDGFR-α的NIH-3T3细胞。用2.5μg/ml VEGFR-2抗体、0.75μg/ml anti-PDGFR-β抗体、0.25μg/ml anti-PDGFR-α抗体及0.5μg/ml anti-KIT抗体包被96孔板, 每孔100ul。或者用1.20μg/ml Flk-1抗体制成酶联免疫吸附(ELISA)捕获板。通过ELISA测定RTK的磷酸化作用。

细胞实验	
细胞系	HUVEC、SH-SY5Y、IGR-N91和IGR-NB8细胞

浓度	1nM-10 μ M
处理时间	72小时
方法	HUVEC、SH-SY5Y、IGR-N91和IGR-NB8细胞系按5 \times 10 ⁴ 密度接种在96孔板上，培养24小时。加入浓度不等(1nM-10 μ M)的Axitinib。72小时后，通过MTS四唑基底物测定细胞活力，计算IC ₅₀ 值。

动物实验	
动物模型	BT474乳腺癌细胞皮下移植到雌性免疫缺陷小鼠内(nu/nu, 8-12周大)
配制	0.5%羧甲基纤维素(CMC)
剂量	10、30或100mg/kg
给药方式	每天口服处理

参考文献：

1. Wilmes LJ, et al. Magn Reson Imaging. 2007; 25(3):319-327.
2. Hu-Lowe DD, et al. Clin Cancer Res. 2008; 14(22):7272-7283.
3. Rossler J. et al. Int J Cancer. 2011; 128(11):2748-2758.
4. Verbeek HH, et al. J Clin Endocrinol Metab. 2011; 96(6):E991-995.
5. Rini BI, et al. Lancet. 2011; 378(9807):1931-1939.
6. Porta C, et al. Med Oncol. 2012; 29(3):1896-1907.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0137-10mM	Axitinib (VEGFR抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC0137-5mg	Axitinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SC0137-25mg	Axitinib (VEGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件：

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项：

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09