

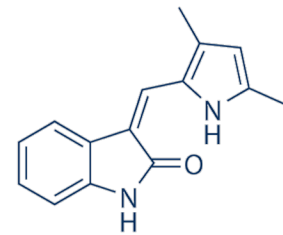
Semaxanib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5274-10mM	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5274-5mg	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5274-25mg	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(3Z)-3-[(3,5-dimethyl-1H-pyrrol-2-yl)methylidene]-1H-indol-2-one
简称	Semaxanib
别名	SU 5416, SU5416, Semoxind
中文名	N/A
化学式	C ₁₅ H ₁₄ N ₂ O
分子量	238.28
CAS号	194413-58-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 22mg/ml ; Ethanol 2mg/ml
溶液配制	5mg加入2.10ml DMSO, 或每2.38mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5274-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Semaxanib (SU5416)是一种有效的, 选择性的VEGFR(Flk-1/KDR)抑制剂, IC ₅₀ 为1.23μM, 作用于VEGFR比作用于PDGFRβ选择性高20倍, 对EGFR、InsR和FGFR没有作用活性。Phase 3。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR2/Flk1	—	—	—	—
IC ₅₀	1.23μM	—	—	—	—
体外研究	在Flk-1过表达的NIH 3T3细胞中, Semaxanib抑制Flk-1受体的VEGF-依赖性磷酸化, IC ₅₀ 为1.04μM。在NIH 3T3细胞中, Semaxanib抑制PDGF依赖性自身磷酸化, IC ₅₀ 为20.3μM。Semaxanib剂量依赖性抑制VEGF和FGF诱发的有丝分裂, IC ₅₀ 分别为0.04和50μM。Semaxanib的治疗对C6胶质瘤, Calu 6肺癌、A375黑素瘤、A431鳞状细胞癌和SF767T神经胶质瘤细胞(IC ₅₀ s都大于20μM)在体外的生长没有影响。				
体内研究	Semaxanib剂量相关性抑制A375肿瘤在体内的生长。Semaxanib每天腹腔注射给药, 能够抑制>85%的皮下肿瘤的生长, 并且没有可检测的毒性。Semaxanib具有广谱的抗肿瘤活性。测试的10种肿瘤细胞系中, Semaxanib显著抑制其中8种(A431、Calu-6、C6、LNCAP、EPH4-VEGF、3T3HER2、488G2M2以及SF767T细胞)的皮下生长, 平均死亡率为2.5%。Semaxanib(25毫克/千克/天)显示出强效抗血管生成活性, 导致肿瘤微血管系统的总功能性血管密度显著降低。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	将来自3T3 Flk-1细胞的膜溶解后加入聚苯乙烯ELISA平板, 平板用能够识别Flk-1的单克隆抗体预涂层。在4℃下, 裂解物培养过夜, 将连续稀释的SU5416加入到免疫定位的受体。为诱导受体的自身磷酸化, 将不同浓度的ATP加入到含有连续稀释的SU5416的ELISA孔板。自身磷酸化在室温下进行60分钟, 然后加入EDTA停止。单个孔中在Flk-1受体上的磷酸酪氨酸的数量, 通过培育免疫定位受体与直接抗磷酸酪氨酸的生物素化的单克隆抗体测定。除去未结合的抗磷酸酪氨酸抗体, 将抗生素蛋白共轭的辣根peroxidase H加入到孔中。稳定形式的3,3',5,5'-四甲基联苯胺盐酸盐和H ₂ O ₂ 加入孔中, 该测定的颜色读数发展30分钟后, 用H ₂ SO ₄ 停止反应。

细胞实验

细胞系	HUVECs
浓度	~100 μ M
处理时间	2天
方法	HUVECs接种在96孔平底平板(1×10^4 细胞/100微升/孔)包含0.5%热灭活FBS的F-12K介质中,并在37°C下培养24小时使细胞静止。连续稀释的化合物在含有1% DMSO的培养基中制备,然后加两小时,接着在培养基中加入促有丝分裂浓度的5纳克/毫升或20纳克/毫升的VEGF或者0.25-5纳克/毫升的酸性成纤维细胞生长因子。测定中DMSO的终浓度为0.25%。24小时后,加入 $[^3\text{H}]$ 胸苷(1 μ Ci/well)或BrdUrd,单层细胞再培育24小时。细胞摄入 $[^3\text{H}]$ 胸苷(1 μ Ci/well)或BrdUrd的量分别通过液体闪烁计数器或BrdUrd ELISA测定。

动物实验	
动物模型	人类黑色素瘤异种移植A375
配制	DMSO
剂量	25毫克/千克
给药方式	每天腹腔注射

➤ 参考文献:

- 1.Fong TA, et al. Cancer Res, 1999, 59(1), 99-106.
- 2.Vajkoczy P, et al. Neoplasia, 1999, 1(1), 31-41.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5274-10mM	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SF5274-5mg	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5274-25mg	Semaxanib (VEGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°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°C保存,预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性,操作时请小心,并注意适当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淀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、体内研究结果或其他相关文献,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 2017.11.01