

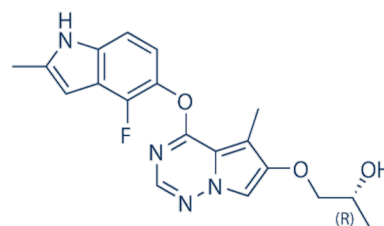
Brivanib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5328-10mM	Brivanib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5328-5mg	Brivanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5328-25mg	Brivanib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(2R)-1-[4-[(4-fluoro-2-methyl-1H-indol-5-yl)oxy]-5-methylpyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazin-6-yl]oxypropan-2-ol
简称	Brivanib
别名	BMS-540215, BMS 540215
中文名	布林佐胺
化学式	C ₁₉ H ₁₉ FN ₄ O ₃
分子量	370.38
CAS号	649735-46-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol 3mg/ml
溶液配制	5mg加入1.35ml DMSO, 或每3.70mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5328-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Brivanib (BMS-540215)是一种ATP竞争性的VEGFR2抑制剂, IC ₅₀ 为25nM, 对VEGFR-1和FGFR-1抑制作用适中, 但比作用于PDGFR-β效果强240多倍。Phase 3。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR2	Flk1	FGFR1	VEGFR1	EGFR
IC ₅₀	25nM	89nM	148nM	380nM	>1.9μM
体外研究	Brivanib也抑制VEGFR-1和FGFR-1, IC ₅₀ 分别为0.38和0.148μM。Brivanib对PDGFR-β、EGFR、LCK、PKCα或JAK-3作用效果不大, IC ₅₀ 都大于1900nM。Brivanib可抑制VEGF刺激的HUVECs细胞增殖, IC ₅₀ 为40nM, 作用于FGF刺激的HUVECs细胞增殖, IC ₅₀ 为276nM。另一方面, Brivanib作用于肿瘤细胞系具有低细胞毒性。				
体内研究	Brivanib作用于携带H3396移植瘤的无胸腺鼠具有抗癌活性。Brivanib按60和90mg/kg剂量口服处理, 完全一致肿瘤生长, TGI分别为85%和97%。而且, Brivanib通过降低VEGFR-2的磷酸化作用而明显抑制肝细胞移植瘤肿瘤生长。结果显示, 与对照组按50mg/kg和100mg/kg剂量处理相比, 携带06-0606移植瘤鼠的体重分别为55%和13%。Brivanib在治疗HCC方面是非常有效的。				
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	在Stf9细胞中, 使用杆状病毒表达载体系统, 使酪氨酸激酶重组蛋白表达为GST融合蛋白。所有酶储存在-80°C。Brivanib溶于DMSO, 用水/10% DMSO稀释。VEGFR-2激酶溶液组成如下: 8ng GST-VEGFR-2酶, 75μg/ml底物, 1μM ATP及0.04μCi [γ-33P]-ATP(溶于50μl buffer, buffer包括20mM Tris pH为7.0, 25μg/ml BSA, 1.5mM MnCl ₂ 及0.5mM二硫苏糖醇)。Flk-1激酶溶液组成如下: 10ng GST-Flk-1酶, 75μg/ml底物, 1μM ATP及0.04μCi [γ-33P]-ATP(溶于50μl buffer, buffer包括20mM Tris, pH为7.0, 25μg/ml BSA, 4mM MnCl ₂ 及0.5mM二硫苏糖醇)。反应在27°C下温育1小时, 加入预冷的三氯乙酸终止反应, 最终浓度为15%。收集沉淀物转移到过滤板上, 用液体闪烁计数器定量。

细胞实验	
细胞系	VEGF或FGF刺激的HUVECs

浓度	10 μ M左右
处理时间	48小时
方法	用浓度为8或80ng/ml的VEGF或FGF刺激细胞。细胞按2 \times 10 ³ 个接种在96孔板上，温育24小时。加入不同浓度Brivanib，处理48小时。加入0.5 μ Ci [³ H]胸苷，处理24小时。使用 β -计数使用器测定渗透的氘。

动物实验	
动物模型	携带H3396移植瘤的无胸腺鼠
配制	溶于PEG400: Tween-80(75:25)(口服)或PEG400: 水(3:2)(静脉注射)
剂量	60mg/kg(口服)或10mg/kg(静脉注射)
给药方式	口服或静脉注射

➤ **参考文献:**

1. Bhide RS, et al., J Med Chem, 2006, 49 (7), 2143-2146.
2. Huynh H, et al. Clin Cancer Res, 2008, 14(19), 6146-6153.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5328-10mM	Brivanib (VEGFR抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SF5328-5mg	Brivanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5328-25mg	Brivanib (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