

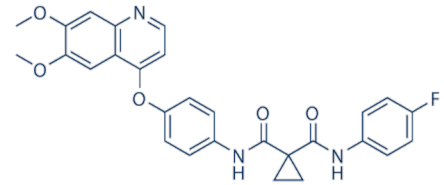
Cabozantinib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5305-10mM	Cabozantinib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5305-5mg	Cabozantinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5305-25mg	Cabozantinib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-N-[4-(6,7-dimethoxyquinolin-4-yl)oxyphenyl]-1-N'-(4-fluorophenyl)cyclopropane-1,1-dicarboxamide
简称	Cabozantinib
别名	XL-184, XL184, BMS-907351, XL 184
中文名	卡博替尼
化学式	C ₂₈ H ₂₄ FN ₃ O ₅
分子量	501.51
CAS号	849217-68-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.00ml DMSO, 或每5.02mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5305-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Cabozantinib (XL184, BMS-907351)是一种有效的VEGFR2抑制剂, 在无细胞试验中IC ₅₀ 为0.035nM, 也能有效抑制 c-Met、 Ret、 Kit、 Flt-1/3/4、 Tie2 和 AXL, IC ₅₀ 分别为 1.3nM、 4nM、 4.6nM、 12nM/11.3nM/6nM、 14.3nM和7nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR2/KDR	c-Met	Kit	VEGFR3/FLT4	Axl
IC ₅₀	0.035nM	1.3nM	4.6nM	6.0nM	7.0nM
体外研究	XL184是多种受体酪氨酸激酶小分子抑制剂, 尤其抑制c-Met和VEGFR2。XL-184也有效作用于Ret、Kit、FLT1、FLT3、FLT4、Tie2和AXL, IC ₅₀ 分别为4nM、4.6nM、12nM、11.3nM、6nM、14.3nM和7nM。XL184微弱抑制RON和PDGFR-β, IC ₅₀ 分别为124nM和234nM, 而对FGFR1则几乎没有抑制活性, IC ₅₀ 为5.294μM。XL184低浓度(0.1-0.5μM)时处理MPNST细胞, 也显著抑制组成型和诱导型Met磷酸化及其下游信号, 且抑制HGF诱导的MPNST细胞迁移和侵袭。XL184作用于细胞因子刺激的人脐静脉内皮细胞(HUVECs), 也显著抑制Met和VEGFR2磷酸化。虽然XL184浓度为0.1μM时不能抑制MPNST细胞生长, 但是浓度为5-10μM时则能显著抑制MPNST细胞生长。				
体内研究	XL184按30mg/kg剂量处理携带自发胰岛细胞瘤的RIP-Tag2小鼠, 扰乱83%肿瘤血管, 降低周细胞和空基底膜袖, 引起广泛瘤内缺氧和广泛的肿瘤细胞凋亡, 且停药后延缓肿瘤血管再生长, 与XL999相比更显著抑制VEGFR而不是c-Met, 导致血管降低43%, 说明抑制VEGFR, 也抑制放大抑制血管新生的其他功能相关的受体酪氨酸激酶(RTK)。XL184也降低原发肿瘤的侵袭和减少转移。XL184每天按30mg/kg剂量处理SCID小鼠, 显著废除人MPNST移植瘤生长和转移。XL184处理乳腺癌, 肺癌胶质瘤模型, 抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 降低肿瘤和内皮细胞增殖, 促进凋亡。XL184按100mg/kg和10mg/kg剂量分别单独处理携带MDA-MB-231肿瘤的小鼠和携带C6肿瘤的大鼠, 持续抑制肿瘤生长。				
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	N/A
细胞实验	

细胞系	ST88-14, STS26T和MPNST724
浓度	溶于DMSO, 终浓度~10 μ M
处理时间	48小时
方法	使用不同浓度XL184处理细胞48小时。通过MTS实验使用CellTiter96 Aqueous非放射性细胞增殖实验试剂盒测定细胞生长。然后在490nm处测定吸光值。

动物实验	
动物模型	携带自发胰岛肿瘤的RIP-TAG2转基因小鼠
配制	悬浮在5mg/ml的无菌生理盐水或水中
剂量	~60mg/kg
给药方式	口服饲喂

➤ **参考文献:**

- 1.You WK, et al. Cancer Res, 2011, 71(14), 4758-4768.
- 2.Torres KE, et al. Clin Cancer Res, 2011, 17(12), 3943-3955.
- 3.Yakes FM, et al. Mol Cancer Ther, 2011, 10(12), 2298-2308.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5305-10mM	Cabozantinib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5305-5mg	Cabozantinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5305-25mg	Cabozantinib (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