

## 甲苯磺酸索拉非尼 ; Sorafenib tosylate ; Bay 43-9006

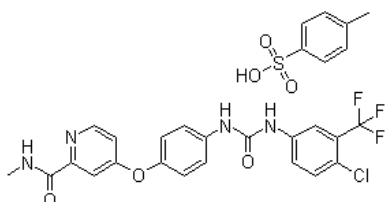
产品编号 : MB1226

质量标准 : >99%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 200MG;1G;5G

产品形式 : 白色或淡黄色粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>16</sub> ClF <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>3</sub> ·C <sub>7</sub> H <sub>8</sub> SO <sub>3</sub>	结构式	
分子量	637.03		
CAS No.	475207-59-1		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (199.36 mM) 溶于 DMF 极微溶于乙醇和水 ( 10~20μM )		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色或淡黄色粉末

熔点 : .....232-234 °C

溶解性 : .....溶于 DMSO ( 100mg/ml ) 和 DMF , 极微溶于乙醇和水 ( 10~20μM )

干燥失重 : .....<1.0%

含量 : .....≥99.0%

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Sorafenib Tosylate 是一种酪氨酸激酶(VEGFR 和 PDGFR)和 RAF/MEK/ERK 级联抑制剂,同时作用于 Raf-1, wtBRAF 和 V599EBRAF, IC <sub>50</sub> 分别为 6 nM, 22 nM 和 38 nM。			
<b>靶点</b>	Raf-1 (Cell-free VEGFR2/Flk1 assay)	B-Raf (Cell-free B-Raf (V599E) assay)	PDGFRβ (Cell-free assay)	
	6 nM	15 nM	22 nM	38 nM
<b>体外研究</b>	Sorafenib 作用于这些细胞系(如 Mia PaCa 2, HCT 116, A549,和 NCI-H460), 抑制 ERK 磷酸化,引起 RAS/RAF 通路的异常激活。Sorafenib 作用于 MDA-MB-231 乳腺癌细胞系, 完全抑制 MAPK 通路的激活。Sorafenib 抑制 MEK 1/2 和 ERK 1/2 磷酸化,这种作用存在剂量依赖性, IC <sub>50</sub> 分别为 40 nM 和 100 nM。Sorafenib 作用于 MDA-MB-231 细胞, 对 PKB 通路没有效果,说明 Sorafenib 选择性抑制 MAPK, 而不抑制 PKB 通路。Sorafenib 作用于人胰脏(Mia PaCa 2)和结肠 (HCT 116 和 HT-29)肿瘤细胞系, 抑制 pERK。Sorafenib 抑制 EGFR,IGFR-1,c-met, 和 HER-2 RTKs , IC <sub>50</sub> >10,000 nM。此外, Sorafenib 有效抑制细胞中 VEGFR-2 信号。Sorafenib 抑制 mVEGFR-2 (flk-1), mVEGFR-3, 和 mPDGFR-β, IC <sub>50</sub> 分别为 15 nM, 20 nM, 和 57 nM。			
<b>体内研究</b>	Sorafenib 按 30 mg/kg 或 60 mg/kg 剂量每天口服处理 HT-29 肿瘤, 与对照组相比, 实验组 50 到 80% MVA 和 MVD 受抑制。Sorafenib 作用于 Colo-205 肿瘤, 可观察到 MVA 和 MVD 明显受抑制, 而不抑制 MAPK。			

**用途及描述**：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.5698 mL	7.8489 mL	15.6978 mL
5 mM		0.3140 mL	1.5698 mL	3.1396 mL
10 mM		0.1570 mL	0.7849 mL	1.5698 mL
50 mM		0.0314 mL	0.1570 mL	0.3140 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验：</b>	<p>生化实验: 测定抑制多种 RAF 激酶亚型的效果, Sorafenib 加到反应 buffer[20 mM Tris (pH 8.2), 100 mM NaCl, 5 mM MgCl<sub>2</sub>, 和 0.15% β-巯基乙醇] 中 Raf-1(80 ng), wtBRAF, 或 V599EBRAF (80 ng) 及 MEK-1 (1 μg)的混合物中, DMSO 终浓度为 1%。加入 25 μL 10 μM γ-[33P]ATP(400 Ci/mol), 开始 RAF 激酶实验(终体积为 50 μL), 在 32 oC 下温育 25 分钟。过滤到磷酸纤维素垫上收集磷酸化的 MEK-1, 使用 1% 磷酸冲洗未结合的放射性。微波加热烘干, 使用 β-计数板测定过滤结合的放射性。</p>
<b>细胞实验：</b>	<p>Cell lines: Colo-205, HT-29, 和 DLD-1 人结肠癌细胞 Concentrations: 0 μM -10 μM Incubation Time: 2 小时 Method: Colo-205, HT-29, 和 DLD-1 人结肠癌细胞系按每孔 2 × 10<sup>5</sup> 个细胞接种在 12 孔组织培养板上, 过夜, 孔中含 DMEM 生长培养基(10% 热灭活 FCS)。使用无血清培养基冲洗细胞一次 然后在含 0.1% 无脂肪酸 BSA 的 DMEM 培养基中 与溶于 0.1% DMSO 的不同浓度 Sorafenib 温育 120 分钟, 测定 pMEK 1/2, pERK 1/2,或 pPKB 的改变量。使用冰冻 PBS (含 0.1 mM 钒酸盐的 PBS) 冲洗细胞, 然后溶于含蛋白酶抑制剂的 1% (v/v) Triton X-100 溶液中。离心净化裂解物, 然后进行 SDS-PAGE,再转移到硝化棉膜上, 然后在 TBS-BSA 中阻断,再使用 anti-pMEK 1/2 (Ser217/Ser221; 1:1000), anti-MEK 1/2, anti-pERK 1/2 (Thr202/Tyr204; 1:1000), anti-ERK 1/2, anti-pPKB (Ser473; 1:1000), 或 anti-PKB 一抗做探针。使用辣根过氧化物酶 ( HRP ) 标记的二抗进行印迹, 然后使用 Amersham ECL 试剂在 Amersham Hyperfilm 上进行显影。</p>
<b>动物实验：</b>	<p>Animal Models: 携带 HT-29 和 Colo-205 细胞的雌性 NCr-nu/nu 小鼠 Formulation: Cremophor EL/乙醇(50:50; 95%乙醇) Dosages: 30 mg/kg 或 60 mg/kg Administration: 口服处理</p>

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。