

## Axitinib ; 阿西替尼

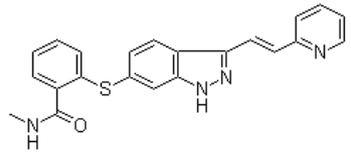
产品编号：MB1394

质量标准：>99%, VEGFR 抑制剂, 细胞培养级

包装规格：100MG;1G;5G

产品形式：类白色至浅黄色粉末

### 基本信息

分子式	C22H18N4OS	结构式	
分子量	386.47		
CAS No.	319460-85-0		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 35 mg/mL warmed (90.56 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
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。		

**简介：**Axitinib 是 Flt 和 Flk 蛋白的非选择性受体激酶抑制剂。研究了阿西替尼作为多种细胞系的抗肿瘤药物。

Axitinib 也是 PDGFR-β 抑制剂。

**别名：**AG 013736;阿西替尼;AG-013736;

N-Methyl-2-((3-((1E)-2-(pyridin-2-yl)ethenyl)-1H-indazol-6-yl)sulfanyl)benzamide;

### 物理性状及指标：

外观：.....类白色至浅黄色粉末

溶解性：.....DMSO : 35 mg/mL warmed (90.56 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

密度：.....~1.4 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重：.....≤0.5%

含量：.....>99%

IC<sub>50</sub> : .....Flt-1: IC<sub>50</sub> = 0.1 nM; Flt-4: IC<sub>50</sub> = 0.1 nM;

.....Flk-1: IC<sub>50</sub> = 0.2 nM; PDGFR-β: IC<sub>50</sub> = 1.6 nM;

.....c-Kit: IC<sub>50</sub> = 1.7 nM

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Axitinib 是一种多靶点抑制剂，作用于 <b>VEGFR1</b> ， <b>VEGFR2</b> ， <b>VEGFR3</b> ，PDGFRβ 和 c-Kit，在猪主动脉内皮细胞中 <b>IC<sub>50</sub></b> 分别为 0.1 nM，0.2 nM，0.1-0.3 nM，1.6 nM 和 1.7 nM。				
<b>特性</b>	Axitinib 与目前使用的 sorafenib 相比，作为二代治疗法，更有效。				
<b>靶点</b>	VEGFR1/FLT1 (Porcine aorta endothelial cells)	VEGFR2/Flk1 (Porcine aorta endothelial cells)	VEGFR2/KDR (Porcine aorta endothelial cells)	VEGFR3 (Porcine aorta endothelial cells)	PDGFRβ (Porcine aorta endothelial cells)

	0.1 nM	0.18 nM	0.2 nM	0.1 nM-0.3 nM	1.6 nM
<b>体外研究</b>	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 1.7 nM。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 >1000 nM, 849 nM, 274 nM 和 573 nM				
<b>体内研究</b>	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。				

**美仑相关产品推荐**

MB1394	阿西替尼
MB3347	德立替尼, E3810
MB5614	乐伐替尼
MB5074	利尼伐尼; ABT869

**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。阿西替尼一种主要靶向于 VEGFR 酪氨酸激酶、抑制血管生成的小分子抗癌药。药理作用：研究表明，阿西替尼能强效、选择性的抑制 VEGF 依赖性受体磷酸化，对 VEGFR-1、VEGFR-2、EGFR-3 的半数抑制浓度 (IC50) 分别为 1.2, 0.25 和 0.29nmol/L。VEGFR 被抑制后，下游的信号传递继而被中断，最终导致细胞无法增殖、甚至死亡。但阿西替尼对成纤维细胞生长因子引起的细胞生长没有抑制作用。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.5875 mL	12.9376 mL	25.8752 mL
5 mM		0.5175 mL	2.5875 mL	5.1750 mL
10 mM		0.2588 mL	1.2938 mL	2.5875 mL
50 mM		0.0518 mL	0.2588 mL	0.5175 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	细胞受体激酶磷酸化实验: 生成过量表达全长 VEGFR-2, PDGFR-β, 和 KIT 的 PAE 细胞, 及过量表达鼠 VEGFR-2 (Flk-1) 或 PDGFR-α 的 NIH-3T3 细胞。用 2.5 μg/mL VEGFR-2 抗体, 0.75 μg/mL anti-PDGFR-β 抗体, 0.25 μg/mL anti-PDGFR-α 抗体, 及 0.5 μg/mL anti-KIT 抗体包被 96 孔板, 每孔 100ul。或者用 1.20 μg/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。
<b>细胞实验</b>	Cell lines: HUVEC, SH-SY5Y, IGR-N91, 和 IGR-NB8 细胞 Concentrations: 1 nM 到 10 μM

	Incubation Time: 72 小时 Method: 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 ( 1 nM 到 10 $\mu$ M ) 的 Axitinib。72 小时后, 通过 MTS 四唑基底物测定细胞活力, 计算 IC50 值。
<b>动物实验</b>	Animal Models: 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 ) Formulation: 0.5% 羧甲基纤维素(CMC) Dosages: 10, 30 或 100 mg/kg Administration: 每天口服处理

**【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 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。