

Cediranib Maleate ; AZD-2171 ; 西地尼布马来酸盐

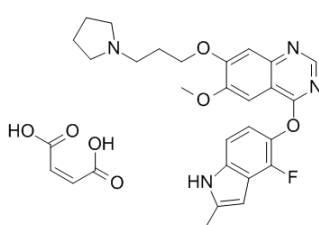
产品编号：MB1787

质量标准：>99%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₇ FN ₄ O ₃ . C ₄ H ₄ O ₄	结构式	
分子量	566.58		
CAS No.	857036-77-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO>45mg/ml 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：西地尼布马来酸盐 Cediranib maleate (AZD-2171 maleate) 是高选择性，有口服活性的 **VEGFR2** 抑制剂，对 Flt1, KDR, Flt4, PDGFR α , PDGFR β , c-Kit 的 **IC₅₀** 值分别为小于 1, 小于 3, 5, 5, 36, 2nM。

别名：AZD-2171 maleate ; Cediranib Maleate;AZD 2171 Maleate;West to Ni BuMa Maleate

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO>45mg/ml ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>99%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	西地尼布马来酸盐 Cediranib maleate (AZD-2171 maleate) 是高选择性，有口服活性的 VEGFR2 抑制剂，对 Flt1, KDR, Flt4, PDGFR α , PDGFR β , c-Kit 的 IC₅₀ 值分别为小于 1, 小于 3, 5, 5, 36, 2nM。					
靶点	Flt-1	KDR	Flt-4	PDGFR α	PDGFR β	c-Kit
	5 nM (IC ₅₀)	1 nM (IC ₅₀)	3 nM (IC ₅₀)	36 nM (IC ₅₀)	5 nM (IC ₅₀)	2 nM (IC ₅₀)
体外研究	在人脐静脉内皮细胞中，Cediranib 抑制 vegf 刺激的增殖和 KDR 磷酸化，IC ₅₀ 分别为 0.4 和 0.5 nM。在成纤维细胞/内皮细胞的血管发芽共培养模型中，Cediranib 在亚纳米级浓度下也减少了血管的面积、长度和分支。					
体内研究	每日口服 Cediranib 消融实验性血管生成(vegf 诱导)，抑制骨内软骨骨化或卵巢黄体发育;高度依赖新血管形成的生理过程。在胸腺小鼠中建立的人类肿瘤异种移植(结肠、肺、前列腺、乳房和卵巢)的生长被 Cediranib 剂量依赖性地抑制，每天每公斤 1.5 mg 的慢性剂量对所有模型产生显著的抑制作用。对用 Cediranib 治疗的 Calu-6 肺肿瘤的组织学分析显示，在 52 小时内微血管密度降低，随着治疗时间的延长，微血管密度逐渐增大。这些变化预示着肿瘤内血管的退化					

美仑相关产品推荐

MB1050

西地尼布;AZD2171

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。本品是一种泛血管内皮生长因子（pan-VEGF）受体酪氨酸激酶抑制剂，主要抑 VEGFR-1、VEGFR-2、VEGFR-3 和 PDGFR。本品能同时抑制 3 种因子的活性，对血管生长占重要地位的 VEGFR-2 受体的抑制作用更强。本品作用于血管和淋巴管，发挥抗血管生成作用，抑制肿瘤的生长和扩散

储液配置

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7650 mL	8.8249 mL	17.6498 mL
5 mM	0.3530 mL	1.7650 mL	3.5300 mL
10 mM	0.1765 mL	0.8825 mL	1.7650 mL
50 mM	0.0353 mL	0.1765 mL	0.3530 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	针对一系列重组酪氨酸激酶[KDR, Flt-1, Flt-4, c-Kit, PDGFR- α , PDGFR- β , CSF-1R, Flt-3, FGFR1, Src, Abl] 测定西地尼布的抑制活性。表皮生长因子受体 (EGFR), ErbB2, Aur-A 和 Aur-B]使用 ELISA 方法
细胞实验	制备头孢地尼作为 DMSO 中的 10 毫米原液，并在相关的分析介质中稀释。 PDGF-AA 诱导 MG63 骨肉瘤细胞增殖，选择性激活 PDGFR- α 同型二聚体信号。细胞在 DMEM 中培养，不含酚醛红，含有 1%的炭脱除 FCS、2 mL 谷氨酰胺和 1%个非必需氨基酸 24 小时。CediRANIB 或载体加入 PDGF-AA 配体 (50 ng/ml)，再加入 72 小时的平板。用溴脱氧尿苷测定细胞增殖
动物实验	小鼠： Cediranib 悬浮于 1% (W/V) 聚山梨酯水溶液 80 (聚氧乙烯；去离子水中山梨糖醇单油酸酯) 中，并以 0.1 毫升/10 克体重给药。对于大鼠的研究，Cediranib 悬浮于 0.5% (W/V) 羟丙基甲基纤维素溶液中，含有 0.1% (W/V) 聚山梨酯水溶液 80，并以 5 mL/kg 体重给予。 大鼠： 年轻女性奥德利公园大鼠 (6 周龄，Wistar 衍生，n = 5) 口服给药，每天一次，用 Cediranib (每天 25mg/kg 每公斤) 或车辆 28 天。额外的大鼠 (每组五只) 用头孢地尼 (每天 5 毫克/公斤) 或车辆治疗 28 天，并在不治疗的情况下再维持 28 天，以检查复合撤退的效果。组织学石蜡切片的股骨关节和卵巢染色 H&E。形态计量分析的股骨胫骨部分，生长板区从股骨和胫骨在每个关节联合起来分析复合治疗的效果。H 和 E 染色卵巢切片中的黄体面积同样通过形态计量学分析确定。

【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。