

Sitravatinib (MGCD516)

产品编号: MB2159

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C33H29F2N5O4S	结构式	
分子量	629.68		
CAS No.	1123837-84-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 100 mg/mL (158.81 mM) Ethanol: 100 mg/mL (158.81 mM) Water: 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: Sitravatinib (MGCD516)是一种新型的、靶向多种参与调节 S180 肉瘤细胞生长的 RTKs 的小分子抑制剂, 包括 c-Kit, PDGFR β , PDGFR α , c-Met 和 Axl。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:DMSO: 100 mg/mL (158.81 mM); Ethanol: 100 mg/mL (158.81 mM); Water: Insoluble

含量:>98%,BR

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性 (仅来自于公开文献, 不保证其有效性)

描述	Sitravatinib (MGCD516)是一种新型的、靶向多种参与调节 S180 肉瘤细胞生长的 RTKs 的小分子抑制剂, 包括 c-Kit, PDGFR β , PDGFR α , c-Met 和 Axl。					
靶点	DDR2 (Cell-free assay)	EPHA3 (Cell-free assay)	Axl (Cell-free assay)	Mer (Cell-free assay)	VEGFR3 (FLT4) (Cell-free assay)	点击
	0.5 nM	1 nM	1.5 nM	2 nM	2 nM	
体外	MGCD516 (Sitravatinib)是一种口服的小分子抑制剂, 抑制一组密切相关的 RTKs, 包括 RET、split					

RTKs (VEGFR, PDGFR 和 KIT)、TRK 家族、DDR2 和 Axl。MGCD516 导致潜在的驱动者 RTKs 的磷酸化被显著抑制、并在体外诱导有效的抗增殖效果。

体内 在含有遗传性变异的 sitravatinib 靶标 (包括 RET, NTRK 或 CHR4q12 的扩增) 的非临床的癌症模型中, Sitravatinib 具有抗肿瘤活性。对异种移植瘤模型进行体内 MGCD516 给药, 可显著抑制肿瘤生长, 其效果优于 imatinib 和 crizotinib (两种已被充分研究的多激酶抑制剂, 具有重叠的目标特异性)。

实验参考方法 (仅来自公开文献, 供参考)

Cell lines: DDLS, LS141 和 MPNST 细胞

Concentrations: 62.5, 125, 250, 500, 1000, 2000 nM/L

Incubation Time: 72 h

细胞实验: Method:

将 2,000-3,000 个细胞铺于 96 孔板, 在含 10% FBS 的 RPMI/DME 培养基中进行培养。第二天, 加入药物, 处理 72 小时后, 将培养基更换为含 10%血清和 10% CKK-8 溶液的培养基 (100 μ L/孔)。孵育 1 小时后, 测得 450 nm 处的 OD 值, 以检测细胞活力。

Reference: Patwardhan PP, et al. Oncotarget. 2016, 7(4):4093-109.

Animal Models: ICR/SCID 小鼠

Formulation: 0.5% 羟丙甲纤维素(HPMC); 0.1% Tween-80 (pH 1.4)

动物实验 Dosages: 15 mg/kg

Administration: p.o.

Reference: Patwardhan PP, et al. Oncotarget. 2016, 7(4):4093-109.

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB1050	西地尼布;AZD2171
MB1229	Sunitinib
MB1261	Vandetanib

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热 (在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.5881 mL	7.9405 mL	15.8811 mL
5 mM	0.3176 mL	1.5881 mL	3.1762 mL

10 mM	0.1588 mL	0.7941 mL	1.5881 mL
50 mM	0.0318 mL	0.1588 mL	0.3176 mL

【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(M ²)	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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在200转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。