

Fruquintinib(HMPL-013) ; 呋喹替尼

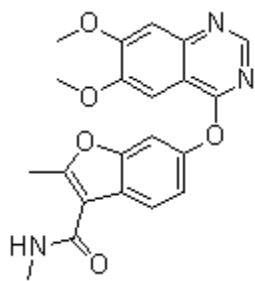
产品编号：MB3103

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：Powder

基本信息

分子式	C21H19N3O5	结 构 式	
分子量	393.39		
CAS No.	1194506-26-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 6 mg/mL (15.25 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：呋喹替尼 Fruquintinib (HMPL-013) 是有效，选择性的 VEGFR 1/2/3 抑制剂，IC₅₀ 值分别为 33，0.5，and 35 nM。

别名：HMPL-013；3-Benzofurancarboxamide, 6-[(6,7-dimethoxy-4-quinazolinyl)oxy]-N,2-dimethyl

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO 6 mg/mL (15.25 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Fruquintinib 是一种高效、高选择性 VEGFR 家族的小分子抑制剂。它抑制 VEGFR 1,2,3, IC ₅₀ 值分别为 33 nM, 35 nM 和 0.5 nM，仅对 RET, FGFR-1 和 c-kit 激酶有较弱的抑制作用。
靶点	IC ₅₀ : 33 nM (VEGFR 1), 0.5 nM (VEGFR 2), 35 nM (VEGFR 3)
体内研究	Fruquintinib 对 HEK293-KDR 细胞中 VEGF-A 依赖性 KDR 磷酸化和 VEGF-A 诱导初级 HUVECs 增殖的抑制作用分别为 0.6 0.2 nM 和 1.7 nM。同样，主要 HLECs 中也观察到 fruquintinib 对 VEGFR3 的有效衰减，IC ₅₀ s 为 1.5 nM, VEGF-C 刺激 VEGFR3 磷酸化和增殖分别为 4.2 nM。Fruquintinib 以浓度依赖的方式抑制管分支、管长和管面积。主要的小管长度 HUVECs 下降了 74%和 94% fruquintinib μM 0.03 和 0.3, 分别。五倍子抑制 HUVEC 小管生长和 CAM 血管生成。管的形成是显著抑制治疗后在 0.3 μM fruquintinib 18 个小时。
体外研究	胃癌 BGC-823 模型对五倍子最敏感。在这个模型中，fruquintinib 可以抑制肿瘤生长 62.3%和 95.4 98.6%，分别为 0.5 和 2 mg/kg，每天一次给药。当剂量增加到 5 mg/kg 和 20 mg/kg 时，肿瘤消退率分别为 24.1%和 48.6%。在不同的异种移植瘤模型中，果 quintinib 的抗肿瘤生长活性水平不同。即使在最低剂量 0.8 mg/kg 时，Fruquintinib 也能显著降低微血管密度。

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
MB3992	瓦他拉尼(PTK787) 2HCl

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。呋喹替尼 Fruquintinib (HMPL-013) 是有效, 选择性的 VEGFR 1/2/3 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5420 mL	12.7100 mL	25.4201 mL
5 mM	0.5084 mL	2.5420 mL	5.0840 mL
10 mM	0.2542 mL	1.2710 mL	2.5420 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	Fruquintinib 最初制备为 DMSO 中的 10mM 储备溶液, 并在合适的测定培养基中稀释。将处于指数期的原代 HUVEC 或 HLEC 悬浮于 100 μ L 含有 0.5%FBS 的 RPMI-1640 培养基中, 并以预先涂有 0.2%明胶或纤连蛋白的 96 孔板中以 5000 细胞/孔接种 并在 5 $^{\circ}$ C 下孵育过夜。% CO ₂ , 37 $^{\circ}$ C 培养箱。 加入 Fruquintinib 和 VEGF-A165 或 VEGF-C (50ng / mL) 并孵育 48 小时。 使用 CCK-8 测定形式测定细胞的活力。
动物实验	将 Fruquintinib 悬浮在 0.5%CMC-Na 水溶液 (w / v) 中并在 4 $^{\circ}$ C 下储存。 小鼠: 在原发肿瘤采用体内连续传代后建立患者来源的异种移植模型。 一旦肿瘤生长至 100-300mm ³ , 动物随机分配每组 6-8 只动物。 小鼠用载体 (对照组) 或 fruquintinib 口服治疗, 剂量范围为 0.5-20mg / kg, 悬浮于载体 (治疗组) 中, 每天一次, 持续 3 周。 在组合研究中, 每周一次通过静脉内注射向裸鼠施用多西紫杉醇(泰索帝 ,5mg / kg)或奥沙利铂(10mg / kg)。 每周测量肿瘤大小和体重 3 次。 计算肿瘤体积 (TV)

【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。