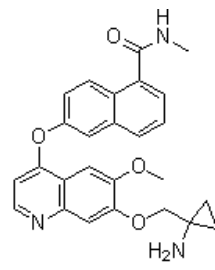


Lucitanib;AL3810;E-3810;德立替尼;E3810

产品编号：MB3347
质量标准：>98%,VEGFRs 和 FGFRs 双重抑制剂
包装规格：5MG;10MG;50MG
产品形式：powder

基本信息

分子式	C26H25N3O4	结 构 式	
分子量	443.49		
CAS No.	1058137-23-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : ≥ 25 mg/mL (56.37 mM)		
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：德立替尼 E-3810是 VEGFR 和 FGFR 的双重抑制剂,有效和选择性地抑制 VEGFR1 ,VEGFR2 ,VEGFR3 , FGFR1 , FGFR2 , IC₅₀分别为 7 nM , 25 nM , 10 nM , 17.5 nM , 82.5 nM。

别名：Lucitanib; AL3810;E-3810;德立替尼;E3810

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色粉末
溶解性：.....DMSO : ≥ 25 mg/mL (56.37 mM)
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	德立替尼 E-3810 是 VEGFR 和 FGFR 的双重抑制剂，有效和选择性地抑制 VEGFR1，VEGFR2，VEGFR3，FGFR1，FGFR2，IC ₅₀ 分别为 7 nM，25 nM，10 nM，17.5 nM，82.5 nM。				
靶点	VEGFR1 7 nM (IC ₅₀)	VEGFR2 25 nM (IC ₅₀)	VEGFR3 10 nM (IC ₅₀)	FGFR1 17.5 nM (IC ₅₀)	FGFR2 82.5 nM (IC ₅₀)
体内研究	与 VEGFR 和 FGFR 自身磷酸化的抑制活性一致，E-3810 有效抑制 VEGF 和 bFGF 刺激的 HUVEC 增殖，IC ₅₀ 分别为 40 和 50nM。此外，E-3810 还抑制 CSF-1R，IC ₅₀ 为 5 nM。E-3810 有效抑制 FGFR2 活性 (Ki <0.05μM)，随后是 PDGFRα活性 (Ki =0.11μM)。对于 DDR2，LYN，CARDIAK，CSBP (2)，EPHA2 和 YES 获得的 Ki 值在 0.26 和 8μM 之间。				
体外研究	E-3810，连续 7 天口服 20mg / kg，与载体处理的小鼠的反应相比，完全抑制 (P <0.01) bFGF 诱导的血管生成反应。E-3810 显示广谱活性，在所有测试的异种移植瘤 (HT29 结肠癌，A2780 卵巢癌，A498，SN12K1 和 RXF393 肾癌)中具有活性，具有剂量依赖性的肿瘤生长抑制。E-3810 显着延缓了治疗期间的生长，但是当治疗暂停时肿瘤恢复生长；在少数情况下，观察到肿瘤消退。以				

	15mg / kg 的剂量给予的 E-3810 的活性在 MDA-MB-231 乳腺癌上进行皮下移植，在肿瘤质量达到 350 至 400mg 的晚期进行。该肿瘤异种移植对 E-3810 非常敏感，在整个 30 天的治疗期间具有完全的肿瘤稳定性。与其他肿瘤模型一样，肿瘤在撤出 E-3810 后以与对照肿瘤相似的速率再生长。
--	---

美仑相关产品推荐

MB7343	Foretinib (GSK1363089)
MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3945	Ki8751

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。德立替尼 E-3810 是 VEGFR 和 FGFR 的双重抑制剂，有效和选择性地抑制 VEGFR1, VEGFR2, VEGFR3, FGFR1, FGFR2, 本品可作为相关癌症治疗领域科研试剂。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2548 mL	11.2742 mL	22.5484 mL
5 mM	0.4510 mL	2.2548 mL	4.5097 mL
10 mM	0.2255 mL	1.1274 mL	2.2548 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）

激酶实验	基于辐射测量过滤器结合测定，使用“激酶分析仪”服务测量激酶选择性。简而言之，使用对应于每种所选激酶的 Michaelis-Menten 常数 (Km) 的 ATP 浓度测试五种不同浓度的 E-3810 (0.1μM, 0.3μM, 1μM, 3μM 和 10μM)，如下所示。条件 [ATP] = Km, 计算抑制剂的解离常数 (Ki) 的通式 - 即 $Ki = IC_{50} \times Km / ([ATP] + Km)$ - 可以简化为 $Ki = IC_{50} / 2$ 。因此，在我们的测定中，测量的 IC 50 与 Ki 成正比。激酶抑制表示为在不存在抑制剂的情况下与在抑制剂存在下测定的活性百分比。使用 GraphPad Prism 使用非线性回归分析来分析绘制效应百分比对 E-3810 的对数浓度的 Sigmoid 浓度 - 响应曲线以获得 IC 50 值，并且使用上述公式计算 Ki 值。
细胞实验	指数增长的 HUVEC 或 NHI3T3 细胞被播种到 96 孔板的密度 3 到 6 10 ³ 个细胞/ 100μL /在完全培养基。在没有血清饥饿的实验中，在播种后 24 小时内，细胞暴露于不同浓度的 E-3810 浓度的 VEGF165 (50 ng/mL)或 bFGF (20 ng/mL)配体下，72 小时后通过 MTS 比色法评价药物的抗增殖作用。在血清饥饿条件下，去除播种完全培养基 24 小时后，PBS 洗涤 3 轮后，细胞在 1% BSA 培养基中培养。18 到 24 小时后，细胞被处理。指数增长的 A2780、A498 SN12KI, HepG2 细胞被播种到 96 孔板在 3 到 5 10 ³ 细胞/ 100μL /在完全培养基。24 小时后用不同浓度的药物治疗 72 小时，用 MTS 评估抗增殖效果。
动物实验	小鼠 MDA-MB-231 荷瘤小鼠随机分组 其肿瘤质量约为 350 至 400 毫克 接受 E-3810 (15 mg / kg), Brivanib 和舒尼替尼，用于抗肿瘤活性试验的剂量，持续 10 天。在第 7 天的抗血管生成剂量后 4 小时，以 20mg / kg 的剂量静脉内注射紫杉醇，并且在所有组（每组包括 3 只动物）中在 1,4 和 24 小时后收集肿瘤和血浆样品。在指定的取样时间，麻醉小鼠，从眼眶后丛收集血液到

肝素化管中，分离血浆部分。通过颈椎脱位杀死小鼠，切除肿瘤并快速冷冻。通过高效液相色谱 (HPLC) 分析样品，在 230nm 下进行 UV 检测。

【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。