

Semaxanib(SU-5416)

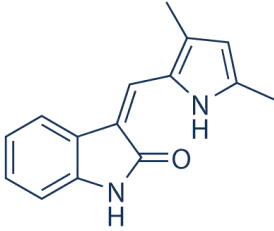
产品编号: MB3934

质量标准: >98%,BR

包装规格: 10mg/200mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C15H14N2O	结构式	
分子量	238.28		
CAS No.	194413-58-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 22 mg/mL (92.33 mM)		
	Ethanol: 2 mg/mL (8.39 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: Semaxanib (SU5416)是一种有效的, 选择性的 VEGFR(FIk-1/KDR)抑制剂, IC50 为 1.23 μ M, 作用于 VEGFR 比作用于 PDGFR β 选择性高 20 倍, 对 EGFR, InsR 和 FGFR 没有作用活性。Phase 3。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: 2 mg/mL (8.39 mM); DMSO: 22 mg/mL (92.33 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

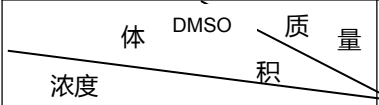
描述	Semaxanib (SU5416)是一种有效的, 选择性的 VEGFR(FIk-1/KDR)抑制剂, IC50 为 1.23 μ M, 作用于 VEGFR 比作用于 PDGFR β 选择性高 20 倍, 对 EGFR, InsR 和 FGFR 没有作用活性。Phase 3。	
IC50 & Target	VEGFR2/FIk1 (Cell-free assay)	
	1.23 μ M	
体外	在 FIk-1 过表达的 NIH 3T3 细胞中, Semaxanib 抑制 FIk-1 受体的 VEGF-依赖性磷酸化, IC50 为 1.04 μ M。在 NIH 3T3 细胞中, Semaxanib 抑制 PDGF 依赖性自身磷酸化, IC50 为 20.3 μ M。Semaxanib 剂量依赖性抑制 VEGF 和 FGF 诱发的有丝分裂, IC50 分别为 0.04 和 50 μ M。Semaxanib 的治疗对 C6 胶质瘤, Calu 6 肺癌, A375 黑素瘤, A431 鳞状细胞癌, 和	

	SF767T 神经胶质瘤细胞(IC50s 都大于 20 μM)在体外的生长没有影响。
体内	Semaxanib 剂量相关性抑制 A375 肿瘤在体内的生长。Semaxanib 每天腹腔注射给药, 能够抑制>85%的皮下肿瘤的生长, 并且没有可检测的毒性。Semaxanib 具有广谱的抗肿瘤活性。测试的 10 种肿瘤细胞系中, Semaxanib 显著抑制其中 8 种(A431, Calu-6, C6, LNCAP, EPH4-VEGF, 3T3HER2, 488G2M2 以及 SF763T 细胞)的皮下生长, 平均死亡率为 2.5%。Semaxanib (25 毫克/千克/天)显示出强效抗血管生成活性, 导致肿瘤微血管系统的总功能性血管密度显著降低。
激酶实验	生化激酶试验: 将来自 3T3 Fik-1 细胞的膜溶解后加入聚苯乙烯 ELISA 平板, 平板用能够识别 Fik-1 的单克隆抗体预涂层。在 4 $^{\circ}\text{C}$ 下, 裂解物培养过夜, 将连续稀释的 SU5416 加入到免疫定位的受体。为诱导受体的自身磷酸化, 将不同浓度的 ATP 加入到含有连续稀释的 SU5416 的 ELISA 孔板。自身磷酸化在室温下进行 60 分钟, 然后加入 EDTA 停止。单个孔中在 Fik-1 受体上的磷酸酪氨酸的数量, 通过培育免疫定位受体与直接抗磷酸酪氨酸的生物素化的单克隆抗体测定。除去未结合的抗磷酸酪氨酸抗体, 将抗生素蛋白共轭的辣根 peroxidase H 加入到孔中。稳定形式的 3,3',5,5'-四甲基联苯胺盐酸盐和 H_2O_2 加入孔中, 该测定的颜色读数发展 30 分钟后, 用 H_2SO_4 停止反应。
细胞实验	Cell lines: HUVECs Concentrations: $\sim 100 \mu\text{M}$ Incubation Time: 2 天 Method: HUVECs 接种在 96 孔平底平板(1×10^4 细胞/100 微升/孔)包含 0.5%热灭活 FBS 的 F-12K 介质中, 并在 37 $^{\circ}\text{C}$ 下培养 24 小时使细胞静止。连续稀释的化合物在含有 1% DMSO 的培养基中制备, 然后加两小时, 接着在培养基中加入促有丝分裂浓度的 5 纳克/毫升或 20 纳克/毫升的 VEGF 或者 0.25-5 纳克/毫升的酸性成纤维细胞生长因子。测定中 DMSO 的终浓度为 0.25%。24 小时后, 加入 ^3H 胸苷($1 \mu\text{Ci}/\text{well}$)或 BrdUrd, 单层细胞再培育 24 小时。细胞摄入 ^3H 胸苷($1 \mu\text{Ci}/\text{well}$)或 BrdUrd 的量分别通过液体闪烁计数器或 BrdUrd ELISA 测定。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: 人类黑色素瘤异种移植 A375 Formulation: DMSO Dosages: 25 毫克/千克 Administration: 每天腹腔注射 (Only for Reference)

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
MB1226	Sorafenib tosylate
MB1230	Sunitinib Malate

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 $^{\circ}\text{C}$ 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 $^{\circ}\text{C}$ 1-3 月; -80 $^{\circ}\text{C}$ 3-6 月。

	1 mg	5 mg	10 mg
---	------	------	-------

1 mM	4.1967 mL	20.9837 mL	41.9674 mL
5 mM	0.8393 mL	4.1967 mL	8.3935 mL
10 mM	0.4197 mL	2.0984 mL	4.1967 mL
50 mM	0.0839 mL	0.4197 mL	0.8393 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。