

Golvatinib ; E7050

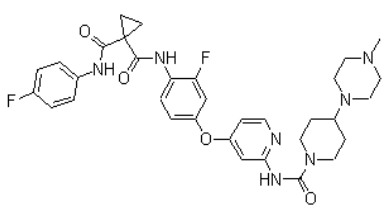
产品编号 : MB3943

质量标准 : >98% , c-Met 和 VEGFR-2 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C33H37F2N7O4	结 构 式	
分子量	633.69		
CAS No.	928037-13-2		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 20 mg/mL (31.56 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 : E-7050 是 c-Met 和 VEGFR2 的双重抑制剂。

别名 : E-7050 ; 1,1-Cyclopropanedicarboxamide, N-[2-fluoro-4-[[[2-[[[4-(4-methyl-1-piperazinyl)-1-piperidinyl]carbonyl]amino]-4-pyridinyl]oxy]phenyl]-N'-(4-fluorophenyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 20 mg/mL (31.56 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	Golvatinib(E7050)是双重 c-Met 和 VEGFR-2 抑制剂, IC50 分别为 14 nM 和 16 nM,不抑制 bFGF 刺激的 HUVEC 生长(浓度高达 1000 nM)。	
靶点	c-Met	VEGFR-2
IC50	14 nM	16 nM

体外研究	体外研究表明 E7050 可以强有效的抑制 c-Met 和 VEGFR-2 的磷酸化。E7050 也可以强有效的抑制 c-met 放大的肿瘤细胞以及 HGF 或 VEGF 刺激的内皮细胞生长。在体外 E7050 通过阻断 Met/Gab1/PI3K/Akt 通路来避免作用于 EGFR 突变的肺癌细胞系中所有外源和内源 HGF 诱导的可逆的，不可逆的以及突变选择性的 EGFR-TKIs。E7050 还可以防止 HCC827 细胞因为 HGF 连续作用而产生的 gefitinib 抗药性
体内研究	体内实验证实 E7050 可以抑制肿瘤中 c-Met 和 VEGFR-2 的磷酸化，在异种移植模型中强烈抑制肿瘤生长和肿瘤血管发生。高剂量 E7050 (50-200 mg/kg) 治疗含有 c-met 扩增的肿瘤细胞系诱导肿瘤恢复和消失。在腹膜模型中 E7050 具有抗腹膜肿瘤活性并可以延长治疗小鼠的寿命。在另一项异种移植模型研究中 Ma-1/HGF 引起的肿瘤比对照肿瘤血管生成更多并具有对 gefitinib 的抗药性。E7050 单用可以抑制 Ma-1/HGF 肿瘤的血管生成和肿瘤生长。E7050 与 gefitinib 联用明显诱导肿瘤退化。

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)

MB3950	MK-2461
MB8803	PHA-665752
MB9673	Tivantinib (ARQ 197)

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。E-7050 是 c-Met 和 VEGFR2 的双重抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.5781 mL	7.8903 mL	15.7806 mL
5 mM		0.3156 mL	1.5781 mL	3.1561 mL
10 mM		0.1578 mL	0.7890 mL	1.5781 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	免疫印迹分析: 免疫印迹法分析 c-Met 和 VEGFR-2 的磷酸化。对于 c-Met, 将 MKN45 与连续稀释的 E7050 在完全培养基中 37 °C 孵育 2 小时。对于 VEGFR-2, HUVEC 细胞在不含血清培养基中饥饿培养 24 小时。然后 HUVEC 与连续稀释的 E7050 孵育 1 小时, 然后与 20 ng/mL 人 VEGF 孵育
-------------	---

	<p>5 分钟。用细胞裂解液(50 mM HEPES [pH 7.4], 150 mM NaCl, 10% 甘油, 1% Triton X-100, 1.5 mM MgCl₂, 1 mM EDTA [pH 8.0], 100 mM NaF, 1 mM 苯甲基磺酰氟, 1 mM 原钒酸钠, 10 μg/mL 抑肽酶, 50 μg/mL 亮抑肽酶, 和 1 μg/mL 胃酶抑素 A)裂解细胞。切下的肿瘤样品混匀在裂解缓冲液中, 缓冲液含有 25 mM β-甘油磷酸盐和 0.5% (v/v) 磷酸酶抑制剂混合物, 储存在 4°C。17860g4°C 离心 20 分钟除去细胞碎片。在还原条件下将含有 5-20 μg 蛋白的上清一部分进行 SDS-PAGE 分析。转至 PVDF 膜上, 用含有 0.05% Tween-20 的 TBS 或 5% 脱脂奶粉或 5% BSA 封闭。用以下抗体标记膜: 抗 c-Met 多克隆抗体(C-28)和抗 VEGFR-2 多克隆抗体(C-20); 鼠源抗磷酸酪氨酸克隆 4G10 以及抗 VEGFR-2 多克隆抗体,抗磷酸化 VEGFR-2 (Tyr996) 多克隆抗体和抗磷酸化 c-Met (Tyr1234/1235) 多克隆抗体。利用增强化学发光试剂盒进行检测。利用 Image Master-VDS-CL 检测系统使免疫反应结果条带可见。利用影响分析仪测量每条条带强度。</p>
<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: MKN45, EBC-1, Hs746T, SNU-5, A549, SNU-1 和 MKN74 Concentrations: 5-5000 nM Incubation Time: 3 天 Method: 细胞($1-3 \times 10^3$ 个/100 μL/孔) 接种在 96 孔板并加入不同浓度的 E7050 然后培养 3 天。每孔加入 10 μL WST-8 试剂, 利用 MTP-500 酶标仪测量 450 nm 处吸光度。HUVEC (2×10^3 个/孔)培养 3 天, 培养基含有 HGF (30 ng/mL), VEGF (20 ng/mL)或碱性成纤维生长因子以及连续稀释的 E7050。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 皮下异种移植模型 Formulation: 无菌蒸馏水配制 Dosages: 50-200 mg/kg Administration: 口服, 一天一次</p>

【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。