

Telatinib

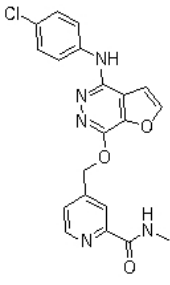
产品编号：MB3995

质量标准：>98%，VEGFR2/3, c-Kit 和 PDGFR β 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C20H16ClN5O3	结 构 式	
分子量	409.83		
CAS No.	332012-40-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：82 mg/mL (200.08 mM)		
	Water 1 mg/mL (2.44 mM)		
	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：Telatinib 是有口服活性的 VEGFR2，VEGFR3，c-Kit 等的小分子抑制剂。

别名：Bay 57-9352；2-Pyridinecarboxamide, 替拉替尼；

4-[[[4-[(4-chlorophenyl)amino]furo[2,3-d]pyridazin-7-yl]oxy]methyl]-N-methyl

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO：82 mg/mL (200.08 mM)；Water 1 mg/mL (2.44 mM)；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	Telatinib (BAY 57-9352) 是有效的 VEGFR2/3, c-Kit 和 PDGFR β 抑制剂, IC50 分别为 6 nM/4 nM, 1 nM 和 15 nM			
靶点	VEGFR-2	VEGFR-3	c-Kit	PGFR- β
IC50	6 nM	4 nM	1 nM	15 nM
体外研究	Telatinib 作用于 VEGFR-3, c-Kit, 和 PDGFR- β 比作用于 VEGFR-2 的 IC50 值分别高 0.66, 0.17, 和 2.5 倍, 而 Vatalanib 分别高 18, 20, 和 16 倍, 说明 Telatinib 效果比 Vatalanib 好。在全细胞实验中, Telatinib 抑制 VEGFR-2 自磷酸化, IC50 为 19 nM, 抑制 VEGF 依赖的人类脐静脉内皮细胞增殖, IC50 为 26 nM, 且阻断 PDGF 刺激的人类主动脉平滑肌细胞生长, IC50 为 249 nM。Telatinib 作用于 Raf 激酶通路, 表皮生长因子受体家族, 成纤维细胞生长因子受体 (FGFR) 家族, 和 Tie-2 受体, 没有抑制活性。			
体内研究	因为肿瘤生长和转移都归因于失去调节的 VEGFR 信号通路, Telatinib 通过阻断 VEGFR 信号和肿瘤血管生成, 而显著抑制肿瘤生长和转移。除了显著抑制肿瘤血管生成外, Telatinib 处理, 显著			

	降低内皮细胞依赖和非依赖的血管舒张, 也降低毛细血管密度, 导致舒张压和收缩压都提高。Telatinib 单独作用于多种人类移植瘤模型, 包括 MDA-MB-231 乳腺癌, Colo-205 结肠癌, DLD-1 结肠癌, 和 H460 非小细胞肺癌, 以及胰腺癌和前列腺癌, 具有有效的抗肿瘤活性, 这种作用存在剂量依赖性。
特征	Telatinib 比其他两种 VEGFR 酪氨酸激酶抑制剂 Sunitinib 和 Sorafenib 具有一些理论优势。

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)

MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3950	MK-2461
MB8803	PHA-665752

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。Telatinib 是有口服活性的 VEGFR2, VEGFR3, PDGF α 和 c-Kit 的小分子抑制剂。本品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	2.4400 mL	12.2002 mL	24.4004 mL
5 mM	0.4880 mL	2.4400 mL	4.8801 mL
10 mM	0.2440 mL	1.2200 mL	2.4400 mL
50 mM	0.0488 mL	0.2440 mL	0.4880 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(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。