

Regorafenib(BAY 73-4506) ; 瑞格非尼(BAY 73-4506)

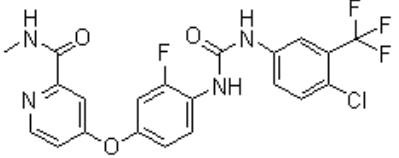
产品编号 : MB5106

质量标准 : >99%,多激酶抑制剂

包装规格 : 10MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C21H15ClF4N4O3	结 构 式	
分子量	482.81		
CAS No.	755037-03-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 97 mg/mL (200.9 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 : Regorafenib (BAY 73-4506) 是一种多靶点受体酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 VEGFR1/2/3, PDGFR β , Kit, RET 和 Raf-1。

别名 : 瑞戈非尼 ; BAY 73-4506 ; 2-Pyridinecarboxamide, 4-[4-[[[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl]amino]carbonyl]amino]-3- fluorophenoxy]-N-methyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至棕色固体

溶解性 :DMSO : 97 mg/mL (200.9 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>99%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Regorafenib 是一个多激酶抑制剂, 靶点有 VEGFR1, 鼠的 VEGFR2, 鼠的 VEGF3, PDGFR- β , KIT, RET 和 RAF-1, IC50 分别是 13 nM, 4.2 nM, 46 nM, 22 nM, 7 nM, 1.5 nM 和 2.5 nM。				
靶点	VEGFR1	鼠源 VEGFR2	鼠源 VEGF3	PDGFR- β	KIT

激酶实验	<p>激酶活性测定: 体外激酶实验用重组的 VEGFR2 (鼠源, aa785-aa1367), VEGFR3 (鼠源 aa818-aa1363), PDGFR-β (aa561-aa1106), RAF-1 (aa305-aa648) 和 BRAFV600E (aa409-aa765)的激酶活性区域进行。初始的激酶抑制反应将 Regorafenib 的浓度固定为 1 μM。IC50 的值根据选定的相应的激酶来测定, 如 VEGFR1 和 RET. TIE2 的激酶抑制效果采用均相时间分辨荧光分析法测定, 利用重组的 TIE2 细胞内区域的 GST 融合蛋白和生物素化的-Ahx-EPKDDAYPLYSDFG 多肽作为底物。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: GIST 882 和 TT 细胞 Concentrations: 5 nM-10 μM Incubation Time: 96 小时 Method: 为了分析细胞增殖情况, 将 GIST 882 和 TT 细胞培养在含有 L-glutamine 谷氨酸的 RPMI 培养基中,MDA-MB-231, HepG2 和 A375 细胞培养在含有 10% hiFBS 的 DMEM 培养基中。将细胞用胰酶消化, 按 5×10^4 个每孔接种在 96 孔板中并在含有 10% FBS 的完全培养基中 37°C 培养过夜。第二天, 将对照和 Regorafenib 用培养基稀释成从 10 μM 到 5 nM 的连续终浓度, 加入 0.2% DMSO,加入细胞培养基中并继续培养 96 小时。将细胞增殖情况进行量化。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 Colo-205, MDA-MB-231 细胞或者 786-O 肿瘤的雌性无胸腺 NCr nu/nu 小鼠 Formulation: 聚乙二醇 400/125 mM 甲磺酸水溶液 (80/20) 或者聚丙烯 乙二醇/聚乙二醇 400/Pluronic F68 (42.5/42.5/15 + 20% 水溶液) Dosages: 3 mg/kg, 10 mg/kg, 30 mg/kg, 100 mg/kg Administration: 口服</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。