

Cabozantinib(BMS907351) ; 卡博替尼 ; XL184

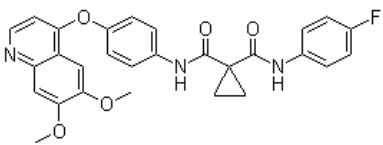
产品编号 : MB5252

质量标准 : >99%,广谱酪氨酸激酶抑制剂

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

| | | | |
|--------------|--|-------------|--|
| 分子式 | C28H24FN3O5 | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 501.51 | | |
| CAS No. | 849217-68-1 | | |
| 储存条件 | -20℃, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25℃) | DMSO : 100 mg/mL (199.39 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 : Cabozantinib 是一种有效的多受体酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 VEGFR2, c-Met, Kit, Axl 和 Flt 等。

别名 : XL184; BMS-907351 ; 1,1-Cyclopropanedicarboxamide, N'-[4-[(6,7-dimethoxy-4-quinolinyl)oxy]phenyl]-N-(4-fluorophenyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (199.39 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>99%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | |
|-------------|---|-------|
| 产品描述 | Cabozantinib (XL184, BMS-907351)是一种有效的 VEGFR2 抑制剂, 在无细胞试验中 IC50 为 0.035 nM, 也能有效抑制 c-Met、Ret、Kit、Flt-1/3/4、Tie2 和 AXL, IC50 分别为 1.3 nM, 4 nM, 4.6 nM, 12 nM/11.3 nM/6 nM, 14.3 nM 和 7 nM。 | |
| 靶点 | VEGFR2/KDR | c-Met |

| | |
|-------------|---|
| | (Cell-free assay) (Cell-free assay) |
| | 0.035 nM 1.3 nM |
| 体外研究 | <p>XL184 是多种受体酪氨酸激酶小分子抑制剂，尤其抑制 c-Met 和 VEGFR2。XL-184 也有效作用于 Ret, Kit, FLT1, FLT3, FLT4, Tie2, 和 AXL，IC50 分别为 4 nM, 4.6 nM, 12 nM, 11.3 nM, 6 nM, 14.3 nM, 和 7 nM。XL184 微弱抑制 RON 和 PDGFR-β，IC50 分别为 124 nM 和 234 nM,而对 FGFR1 则几乎没有抑制活性，IC50 为 5.294 μM。XL184 低浓度(0.1-0.5 μM) 时处理 MPNST 细胞，也显著抑制组成型和诱导型 Met 磷酸化及其下游信号，且抑制 HGF 诱导的 MPNST 细胞迁移和侵袭。XL184 作用于细胞因子刺激的人脐静脉内皮细胞 (HUVECs)，也显著抑制 Met 和 VEGFR2 磷酸化。虽然 XL184 浓度为 0.1 μM 时不能抑制 MPNST 细胞生长，但是浓度为 5-10 μM 时则能显著抑制 MPNST 细胞生长。</p> |
| 体内研究 | <p>XL184 按 30 mg/kg 剂量处理携带自发胰岛细胞瘤的 RIP-Tag2 小鼠，扰乱 83%肿瘤血管，降低周细胞和空基底膜袖，引起广泛瘤内缺氧和广泛的肿瘤细胞凋亡，且停药后延缓肿瘤血管再生长，与 XL999 相比更显著抑制 VEGFR 而不是 c-Met，导致血管降低 43%，说明抑制 VEGFR，也抑制放大抑制血管新生的其他功能相关的受体酪氨酸激酶 (RTK)。XL184 也降低原发肿瘤的侵袭和减少转移。XL184 每天按 30 mg/kg 剂量处理 SCID 小鼠，显著废除人 MPNST 移植瘤生长和转移。XL184 处理乳腺癌，肺癌胶质瘤模型，抑制肿瘤生长，这种作用存在剂量依赖性，降低肿瘤和内皮细胞增殖，促进凋亡。XL184 按 100 mg/kg 和 10 mg/kg 剂量分别单独处理携带 MDA-MB-231 肿瘤的小鼠和携带 C6 肿瘤的大鼠，持续抑制肿瘤生长。</p> |

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)

| | |
|--------|------------|
| MB4527 | BFH772 |
| MB3946 | BMS-794833 |
| MB2026 | BMS582664 |

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。Cabozantinib 是一种有效的多受体酪氨酸激酶抑制剂，抑制 VEGFR2，c-Met，Kit，Axl 和 Flt 等。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 | 1.9940 mL | 9.9699 mL | 19.9398 mL |
| 5 mM | 0.3988 mL | 1.9940 mL | 3.9880 mL |
| 10 mM | 0.1994 mL | 0.9970 mL | 1.9940 mL |

| | | | |
|-------|-----------|-----------|-----------|
| 50 mM | 0.0399 mL | 0.1994 mL | 0.3988 mL |
|-------|-----------|-----------|-----------|

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|-------------|---|
| 细胞实验 | <p>Cell lines: ST88-14, STS26T, 和 MPNST724</p> <p>Concentrations: 溶于 DMSO,终浓度~10 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 使用不同浓度 XL184 处理细胞 48 小时。通过 MTS 实验使用 CellTiter96 Aqueous 非放射性细胞增殖实验试剂盒测定细胞生长。然后在 490 nm 处测定吸光值。</p> |
| 动物实验 | <p>Animal Models: 携带自发胰岛肿瘤的 RIP-TAG2 转基因小鼠。</p> <p>Formulation: 悬浮在 5 mg/mL 的无菌生理盐水或水中</p> <p>Dosages: ~60 mg/kg</p> <p>Administration: 口服饲喂</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。