

Cabozantinib (S)-malate(BMS907351-(S)-malate)**卡博替尼苹果酸盐 ; XL184(S)-malate**

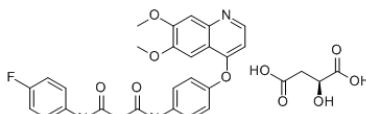
产品编号 : MB5345

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	C ₂₈ H ₂₄ FN ₃ O ₅ .C ₄ H ₆ O ₅	结 构 式	
分子量	635.60		
CAS No.	1140909-48-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (157.33 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 (S-malate)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 Flt3。

别名 : 卡博替尼苹果酸盐 ; XL184; Cabozantinib ; Butanedioic acid, 2-hydroxy-, (2S)-, compd. with N-[4-[(6,7-dimethoxy-4-quinolinyl)oxy]phenyl]-N'-(4-fluorophenyl)-1,1-cyclopropanedicarboxamide (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (157.33 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	Cabozantinib malate (XL184)是 Cabozantinib 的苹果酸盐, 是有效的 VEGFR2 抑制剂, IC ₅₀ 为 0.035 nM, 也抑制 c-Met, Ret, Kit, Flt-1/3/4, Tie2 和 AXL, 无细胞试验中 IC ₅₀ 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 (Cell-free assay)	c-Met (Cell-free assay)
	0.035 nM	1.3 nM
体外研究	Cabozantinib 对 RON 和 PDGFR β 具有弱的抑制活性, IC50 分别为 124 nM 和 234 nM, 并且对 FGFR1 具有微弱的活性, IC50 为 5.294 μ M。Cabozantinib 在低浓度(0.1-0.5 μ M)下足以显著抑制 MPNST 细胞中组成型和诱导型 Met 磷酸化的产生和其所得的下游信号, 并且抑制 HGF-诱导的 MPNST 细胞迁移和侵袭。在细胞因子刺激的人脐静脉内皮细胞中(HUVECs), Cabozantinib 也会显著抑制 Met 和 VEGFR2 磷酸化作用。虽然 Cabozantinib 在 0.1 μ M 下对 MPNST 细胞生长没有显著的作用, 但是在 5-10 μ M 下显著抑制 MPNST 细胞生长。	
体内研究	患有自发性胰岛肿瘤的 RIP-Tag2 小鼠体内, Cabozantinib 以 30 mg/kg 的剂量治疗破坏 83% 的肿瘤血管, 减少周皮细胞和空的基底膜套, 引起广泛的瘤内缺氧和大量癌细胞凋亡, 并且在药物戒断后肿瘤血管重新生长, 与 XL999 相比, 更显著地阻断 VEGFR, 而不阻断 c-Met, 导致血管分布仅减少 43%, 表明 VEGFR 的并发抑制和其它功能相关的受体酪氨酸激酶 (RTK) 放大了血管生成的抑制作用。Cabozantinib 也会减少原发性肿瘤的侵袭, 并减少转移。在 SCID 小鼠中, Cabozantinib 在 30 mg/kg/day 下显著废除人 MPNST 异种移植物的生长和转移。Cabozantinib 给药剂量依赖性抑制肿瘤在乳腺癌, 肺癌, 以及神经胶质瘤肿瘤模型中的生长, 这与减少的肿瘤和内皮细胞增殖以及增加的细胞凋亡相关。在负荷 MDA-MB-231 肿瘤的小鼠和 C6 肿瘤的大鼠体内, Cabozantinib 分别以 100 mg/kg 和 10 mg/kg 单剂量口服给药足以诱导持续的肿瘤生长抑制。	

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)

MB3945	Ki8751
MB4527	BFH772
MB3995	Telatinib

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 (S-malate) 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 Flt3。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	1.5733 mL	7.8667 mL	15.7334 mL
5 mM	0.3147 mL	1.5733 mL	3.1467 mL
10 mM	0.1573 mL	0.7867 mL	1.5733 mL

50 mM	0.0315 mL	0.1573 mL	0.3147 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: 溶解于 DMSO, 终浓度为~10 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 细胞在各种浓度的 Cabozantinib 下暴露 48 小时。细胞生长通过 MTS 试验使用 CellTiter96 含水非放射性细胞增殖测定试剂盒测定。吸光度在 490 nm 波长下测量, 处理细胞的吸光值表示为未处理细胞吸光度的百分比。</p>
动物实验	<p>Animal Models: RIP-Tag2 转基因小鼠, 以伴随自发性胰岛肿瘤的 C57BL/6 亚系为本底</p> <p>Formulation: 以 5 mg/mL 的浓度悬浮在无菌盐水或者水中</p> <p>Dosages: ~60 mg/kg</p> <p>Administration: 口服强饲</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。