

## Lenvatinib(E7080) ; 乐伐替尼

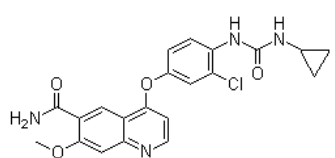
产品编号 : MB5614

质量标准 : >98%,VEGFR 抑制剂

包装规格 : 10MG ; 100MG ; 1G

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C21H19ClN4O4	结 构 式	
分子量	426.85		
CAS No.	417716-92-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 40 mg/mL warmed (93.7 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 :** Lenvatinib 是一种口服, 多靶点酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 VEGFR2(KDR) 和 VEGFR3(Flt-4)。

**别名 :** 乐伐替尼 ; E7080 ; 6-Quinolinecarboxamide, 4-[3-chloro-4-[[[(cyclopropylamino)carbonyl]amino]phenoxy]-7-methoxy

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至灰色固体

溶解性 : .....DMSO 40 mg/mL warmed (93.7 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

<b>产品描述</b>	Lenvatinib (E7080)是一种多靶点抑制剂, 无细胞试验中, 作用于 VEGFR2(KDR)/VEGFR3(Flt-4) 最有效, IC50 为 4 nM/5.2, 对 VEGFR1/Flt-1 作用效果稍弱, 作用于 VEGFR2/3 比作用于 FGFR1, PDGFR $\alpha$ / $\beta$ 选择性高 10 倍左右。				
<b>特性</b>	E7080 是口服有效的多靶点激酶抑制剂。				
<b>靶点</b>	VEGFR2/KDR	VEGFR3/FLT4	VEGFR1/FLT1	PDGFR $\beta$	FGFR1

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	4.0 nM	5.2 nM	22 nM	39 nM	46 nM
<b>体外研究</b>	E7080 有效抑制血管生成, 也显著抑制 VEGF/KDR 和 SCF/KIT 信号通路。根据体外受体酪氨酸和丝/苏氨酸激酶实验, E7080 抑制 Flt-1, KDR, 和 Flt-4 时, IC50 分别为 22, 4.0 和 5.2 nM。除了这些激酶, E7080 也抑制 FGFR1 和 PDGFR 酪氨酸激酶, 作用于 FGFR1, PDGFR $\alpha$ 和 PDGFR $\beta$ 时, IC50 分别为 46, 51 和 100 nM。E7080 分别作用于由 VEGF 和 VEGF-C 刺激的 HUVECs, 有效抑制 VEGFR2 和 VEGFR3 磷酸化, IC50 分别为 0.83 nM 和 0.36 nM。最新研究显示用 1 $\mu$ M 和 10 $\mu$ M E7080 处理, 通过抑制 FGFR 和 PDGFR 信号通路, 而明显抑制细胞迁移和入侵。				
<b>体内研究</b>	E7080 按 30 和 100 mg/kg 剂量口服给药处理 H146 移植瘤模型, 抑制 H146 肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 按 100 mg/kg 剂量时导致肿瘤衰退。而且, E7080 按 100 mg/kg 剂量处理, 比 VEGF 抗体和 Imatinib 处理, 更加降低微血管密度。				

**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)**

MB5074	利尼伐尼; ABT869
MB3992	瓦他拉尼(PTK787) 2HCl
MB2944	瓦特拉尼碱

**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。Lenvatinib 是一种口服, 多靶点酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 VEGFR2(KDR) 和 VEGFR3(Flt-4)。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	2.3427 mL	11.7137 mL	23.4274 mL
5 mM	0.4685 mL	2.3427 mL	4.6855 mL
10 mM	0.2343 mL	1.1714 mL	2.3427 mL
50 mM	0.0469 mL	0.2343 mL	0.4685 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	体外激酶试验:
-------------	---------

	<p>通过 HTRF(KDR, VEGFR1, FGFR1, c-Met, EGFR)和 ELISA(PDGFR<math>\beta</math>), 使用重组受体激酶域进行酪氨酸激酶实验。实验中, 4 <math>\mu</math>L 连续稀释的 E7080 与 10 <math>\mu</math>L 酶, 16 <math>\mu</math>L 聚(GT)溶液(250 ng) 和 10 <math>\mu</math>L ATP 溶液 (1 <math>\mu</math>mol/L ATP) (DMSO 终浓度为 0.1%)在 96 孔板上混合。空白对照孔中不加酶, 也不加样品。每孔加入 ATP 溶液开始进行激酶反应。30<math>^{\circ}</math>C 下反应 30 分钟后, 通过在每孔反应混合物中通过加入 10 <math>\mu</math>L 0.5 mol/L EDTA 终止反应。在反应混合物中针对每种激酶实验加入足够的稀释 buffer。HTRF 实验中, 50 <math>\mu</math>L 反应混合物转移到 96 孔 1/2 面积黑暗 EIA/RIA 板上, 在反应混合物中加入 HTRF 溶液(50 <math>\mu</math>L/孔), 然后通过荧光测定使用时间分辨荧光检测仪而测定激酶活性。ELISA 实验中, 50 <math>\mu</math>L 反应混合物在抗生素蛋白包被的 96 孔板上室温下温育 30 分钟。用冲洗 buffer 冲洗后, 加入 PY20-HRP 溶液 (70 <math>\mu</math>L/孔), 然后反应混合物在室温下温育 30 分钟。用冲洗 buffer 冲洗后, 每孔加入 100 <math>\mu</math>L TMB 试剂。10-30 分钟后, 每孔加入 100 <math>\mu</math>L 1 mol/L H<sub>3</sub>PO<sub>4</sub>。使用酶标仪在 450 nm 测定吸光度而测定酶活性。</p>
<p><b>细胞实验</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> HUVECs  <b>Concentrations:</b> 0 到 10 <math>\mu</math>M  <b>Incubation Time:</b> 72 小时  <b>Method:</b> HUVECs(每孔 1,000 个细胞, 在含 2%FBS 的无血清培养基中), L6 大鼠骨骼肌成肌细胞(每孔 5,000 个细胞, 在无血清 DMEM 培养基中)分布在 96 孔板上, 温育过夜。每孔加入 E7080, 含 2% FBS 的 VEGF(20 ng/mL)或 FGF-2(20 ng/mL), 和 PDGF<math>\beta</math>(40 ng/mL)。细胞温育 3 天, 然后使用 WST-1 试剂测定细胞存活率。增殖实验中, 重复样本, 进行三个独立实验。</p>
<p><b>动物实验</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> 体侧皮下注射 H146 肿瘤细胞的雌性 BALB/c 裸鼠  <b>Formulation:</b> E7080 溶于 0.5%甲基纤维素  <b>Dosages:</b> <math>\leq</math>100 mg/kg  <b>Administration:</b> 口服处理</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。