

Tivozanib ; AV951 ; AV-951

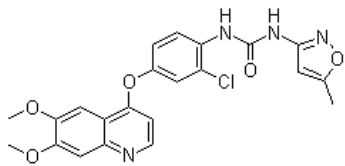
产品编号 : MB5631

质量标准 : >98%, VEGFR 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₂ H ₁₉ ClN ₄ O ₅	结 构 式	
分子量	454.86		
CAS No.	475108-18-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 20 mg/mL (43.96 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 : Tivozanib (AV-951; KRN951) 是有效, 选择性的 VEGFR 1/2/3 抑制剂。

别名 : 替沃扎尼 ; AV-951; KRN951 ; Urea, N-[2-chloro-4-[(6,7-dimethoxy-4-quinolinyl)oxy]phenyl]-N'-(5-methyl-3-isoxazolyl)-

物理性状及指标 :

外观 :浅棕色至棕色固体

溶解性 :DMSO : 20 mg/mL (43.96 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

产品描述	Tivozanib (AV-951)是一种有效的, 选择性 VEGFR 抑制剂, 作用于 VEGFR1/2/3 时, IC ₅₀ 分别为 0.21 nM/0.16 nM/0.24 nM, 也抑制 PDGFR 和 c-Kit, 作用于 FGFR-1, Flt3, c-Met EGFR 和 IGF-1R 活性较弱。
-------------	---

靶点	VEGFR2 (Cell-free assay)	VEGFR3 (Cell-free assay)	EphB2 (Cell-free assay)	VEGFR1 (Cell-free assay)	PDGFR α (Cell-free assay)
	6.5 nM	15 nM	24 nM	30 nM	40 nM
体外研究	AV-951 也抑制 PDGFR β 和 c-Kit 的磷酸化作用, IC50 分别为 1.72nm 和 1.63nM。AV-951 阻断 VEGF 依赖的 MAPK 活性和内皮细胞增殖。AV-951 是新型喹啉-尿素派生物。				
体内研究	活体研究显示 AV-951 降低移植瘤微血管密度和抑制移植瘤 VEGFR-2 磷酸化作用水平, 尤其当 AV-951 浓度为 1mg/kg (口服处理)。在无胸腺鼠中 AV-951 几乎抑制全部的移植瘤生长, 肿瘤生长抑制率 (TGI) >85%。[1]AV-951 作用于人类移植瘤模型包括肺, 胸腺, 结肠, 卵巢, 胰脏和前列腺癌, 显示出抗癌活性。鼠类腹膜弥散肿瘤模型研究显示 AV-951 可延长肿瘤携带鼠的寿命。				

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)

MB4530	ENMD-2076
MB7343	Foretinib (GSK1363089)
MB3943	Golvatinib (E7050)

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。Tivozanib (AV-951; KRN951) 是有效, 选择性的 VEGFR 1/2/3 抑制剂。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	2.1985 mL	10.9924 mL	21.9848 mL
5 mM	0.4397 mL	2.1985 mL	4.3970 mL
10 mM	0.2198 mL	1.0992 mL	2.1985 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶实验: 加入 1 μmol/L ATP 进行无细胞激酶实验, 分四组进行, 测定 AV-951 作用于重组受体和非受体酪氨酸激酶的 IC50 值。用于细胞实验, 细胞在含 0.5% FBS 的培养基中饥饿过夜。加入 AV-951 或 0.1% DMSO, 温育 1 小时, 然后在 37$^{\circ}$C 下加入同源配体诱导。诱导受体磷酸化持续 5 分</p>
------	---

	钟。加溶解 buffer(包含 1% NP40, 0.5%脱氧胆酸钠, 0.1% SDS, 100 µg/mL 苯甲磺酰氟, 1 mmol/L Na3VO4,及溶于 PBS 中的 3% 抑肽酶)溶解细胞。然后加入合适的抗体进行免疫沉淀反应, 及加入磷酸酪氨酸进行免疫印迹。分析回归曲线计算 IC50 值。
细胞实验	<p>Cell lines: 人类脐静脉内皮细胞(HUVEC) 和正常人类皮肤成纤维细胞</p> <p>Concentrations: 1 µM</p> <p>Incubation Time: 15 分钟</p> <p>Method: 癌细胞接种在 96 孔板上, 在含 10% FBS 的培养基上培养 24 小时。加入 AV-951, 温育 72 小时。使用 WST-1 试剂探测细胞活力。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 无胸腺鼠(RH-rnu/rnu)</p> <p>Formulation: 溶于蒸馏水的 0.5%甲基纤维素</p> <p>Dosages: 1 mg/kg</p> <p>Administration: 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, 否则会严重影响化合物活性, 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。给药剂量的时候, 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。