

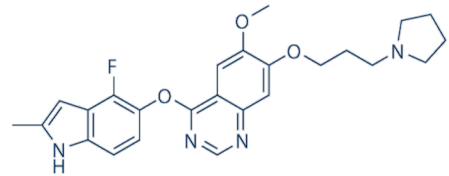
Cediranib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5287-10mM	Cediranib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5287-5mg	Cediranib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5287-25mg	Cediranib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[(4-fluoro-2-methyl-1H-indol-5-yl)oxy]-6-methoxy-7-(3-pyrrolidin-1-ylpropoxy)quinazoline
简称	Cediranib
别名	Recentin, AZD2171, AZD 2171, Cediranib (AZD2171)
中文名	西地尼布
化学式	C ₂₅ H ₂₇ FN ₄ O ₃
分子量	450.51
CAS号	288383-20-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 90mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.11ml DMSO, 或每4.51mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5287-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Cediranib (AZD2171)是一种高效的VEGFR(KDR)抑制剂, IC ₅₀ 为<1nM, 同时也抑制Flt1/4, IC ₅₀ 为5nM≤3nM, 此外对c-Kit和PDGFRβ也具有相似的抑制活性, 对VEGFR的选择性比PDGFR-α、CSF-1R和Flt3分别高36倍、110倍和1000倍以上。Phase 3。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR2/KDR	c-Kit	VEGFR3/FLT4	VEGFR1/FLT1	PDGFRβ
IC ₅₀	0.5nM	2nM	≤3nM	5nM	5nM
体外研究	Cediranib抑制bFGF和EGF时IC ₅₀ 分别为0.5和0.11μM。在MG63细胞系中, Cediranib抑制PDGF-AA, IC ₅₀ 为0.04μM。Cediranib抑制Flt-1相关激酶, IC ₅₀ 为5nM, Cediranib抑制VEGF-C和VEGF-D受体Flt-4, IC ₅₀ 小于3nM。此外, cediranib抑制c-Kit和PDGFR-β酪氨酸激酶, IC ₅₀ 分别为2和5nM。在体外, 微摩尔浓度cediranib可直接抑制肿瘤细胞增殖。次纳摩尔浓度Cediranib阻断细管产生, 且抑制体内VEGF诱导的血管生成。				
体内研究	Cediranib造成骨骼过度生长, 阻止卵巢中黄体的产生, 依赖于血管生成的生理程序被抑制。Cediranib非常有效作用于人类移植瘤模型, 存在剂量依赖性。此外, cediranib导致人类肺癌移植瘤血管衰退。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	AZD2171溶解在DMSO中, 浓度为10mM。使用ELISA测定AZD2171作用于KDR、Flt-1、Flt-4、c-Kit、PDGFR-α、PDGFR-β、CSF-1R、Flt-3、FGFR1、Src、Abl、EGFR、ErbB2、Aur-A和Aur-B的抑制效果。使用闪烁接近法, 加入视网膜神经瘤底物和[γ-33P]ATP测定抗CDK和CDK4丝/苏氨酸激酶的选择性。使用闪烁计数器, 加入MAPK底物和[γ-33P]ATP测定抗MEK的活性。

细胞实验	
细胞系	HUVEC细胞系
浓度	10μM
处理时间	72小时
方法	加入3H-胸苷, 温育4天后, 测定HUVEC细胞增殖。PDGF-AA选择性激活PDGFR-α同型二聚体信号, 诱

	导MG63骨肉瘤细胞增殖。HUVEC和MG63骨肉瘤细胞培养在DMEM培养基中，培养基没有加酚红但是含有1%炭吸附FCS，2mM谷氨酸及1%非必需氨基酸，培养24小时。实验组在PDGF-AA配位体中加入AZD2171，预温育72小时。使用溴脱氧尿苷ELISA测定细胞增殖。
--	--

动物实验	
动物模型	雌性Alderley Park鼠
配制	Suspended in 1% (w/v) aqueous polysorbate 80
剂量	5mg/kg
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

1. Wedge SR, et al. Cancer Res, 2005, 65(10), 4389-4400.
2. Morton CL, et al. Pediatr Blood Cancer, 2012, 58(4), 566-571.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5287-10mM	Cediranib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5287-5mg	Cediranib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5287-25mg	Cediranib (VEGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01