

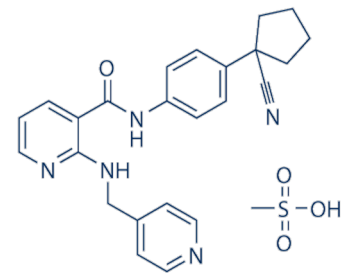
## Apatinib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5454-10mM	Apatinib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5454-5mg	Apatinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5454-25mg	Apatinib (VEGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-[4-(1-cyanocyclopentyl)phenyl]-2-(pyridin-4-ylmethylamino)pyridine-3-carboxamide; methanesulfonic acid
简称	Apatinib
别名	UNII-TK02X14ASJ, YN968D1, YN-968D1, 1218779-75-9
中文名	阿帕替尼
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>27</sub> N <sub>5</sub> O <sub>4</sub> S
分子量	493.58
CAS号	811803-05-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 22mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.01ml DMSO, 或每4.94mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5454-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Apatinib是一种口服生物有效性的VEGFR2选择性抑制剂, IC <sub>50</sub> 为1nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR2	RET	c-Kit	c-Src	PDGFR $\alpha$
IC <sub>50</sub>	1nM	13nM	429nM	530nM	>1 $\mu$ M
体外研究	Apatinib(YN968D1)是一种新型的, 具有口服生物有效性的, 选择性的抑制剂, 具有潜在的抗血管生成和抗肿瘤活性。Apatinib选择性与VEGF2结合并对其抑制作用。Apatinib也有效抑制Ret、c-kit和c-src的活性, IC <sub>50</sub> 分别为0.013 $\mu$ M、0.429 $\mu$ M和0.53 $\mu$ M。Apatinib抑制VEGFR-2、c-kit和PDGFR $\beta$ 的细胞磷酸化。Apatinib显著抑制20ng/mlVEGF刺激的细胞增殖(IC <sub>50</sub> =0.17 $\mu$ M)。Apatinib有效抑制FBS诱导的人脐静脉内皮细胞增殖, 迁移和血管形成, 也抑制大鼠主动脉环的形成。Apatinib通过抑制其运输功能而逆转ABCB1和ABCG2介导的MDR, 而不是通过阻断AKT或ERK1/2通路或下调ABCB1或ABCG2的表达。Apatinib作用于ABCB1或ABCG2过表达的细胞, 显著增加形成的ABCB1和ABCG2底物的细胞毒性, 并增加了DOX和Rho 123的累积。				
体内研究	Apatinib抑制多种人类移植瘤的生长, 这种作用具有剂量依赖性。Apatinib处理携带移植瘤的裸鼠, 逆转ABCB1调节的MDR。Apatinib作用于携带K562/ADR移植瘤的裸鼠, 显著增强Doxorubicin的抗肿瘤活性。				
临床实验	N/A				
特征	与Sorafenib和Sunitinib相比, Apatinib(YN968D1)治疗胃癌和大肠癌具有更好的抗癌效果。				

#### ➤ 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	使用聚(谷氨酸, 丙氨酸, 酪氨酸)6:3:1的无规共聚物作为含酪氨酸的底物溶液。底物按1mg/ml储存在PBS中, -20°C下保存, 使用PBS按1:500稀释, 然后包被在96孔板中(每孔100 $\mu$ l)。实验板在实验前一天进行包被, 使用粘合剂密封进行密封, 并在4°C下贮存过夜。使用PBST(含0.05% v/v Tween 20的PBS)洗涤实验板一次, 再用Hepes buffer(50mM, pH 7.4)洗涤一次。使用10% DMSO的去离子水稀释试验化合物, 25 $\mu$ l转移到洗涤试验板的孔中。然后所有实验孔中加入含8 $\mu$ M ATP的MnCl <sub>2</sub> 溶液(40mM, 25 $\mu$ l)。含有化合物稀释液和MnCl <sub>2</sub> 溶液, 有或无ATP的对照和空白孔也进行动态范围检测。每孔加入新鲜稀释的酶(50 $\mu$ l), 实验板在室温下温育20分钟。移除液体, 使用PBST将实验孔洗涤两次。每孔加入含0.5%

	(w/v)牛血清白蛋白(BSA)的PBST(100μl), 将小鼠IgG抗磷酸酪氨酸抗体按1:6000稀释, 实验板在室温下温育1小时后, 移除液体, 使用PBST洗涤实验孔两次。每孔加入含0.5% (w/v) BSA的PBST(100μl), 将辣根过氧化物酶(HRP)联和的羊抗鼠Ig抗体按1:500稀释, 实验板在室温下再温育1小时后, 移除液体, 使用PBST洗涤实验孔两次。在50mM含0.03% (w/v) 过硼酸钠的磷酸盐-柠檬酸盐buffer (pH5.0)中制备新鲜的1mg/ml 2,2'-连氨基-双(3-乙基苯并二氢噻唑啉-6-磺酸)溶液, 每孔加入100μl。实验板在室温下再温育20-60分钟, 直到在405nm处测量的对照孔的光密度值约为1.0。测定IC50值。
--	---

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	携带Ls174t、HCT 116、SGC-7901、HT-29、A549、NCI-H460移植瘤的BALB/cA裸鼠
配制	0.5% (w/v)羧甲基纤维素
剂量	50, 100, 200mg/kg
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

- 1.Tian S, et al. Cancer Sci, 2011, 102(7), 1374-1380.
- 2.Mi YJ, et al. Cancer Res, 2010, 70(20), 7981-7991.
- 3.Tong XZ, et al. Biochem Pharmacol, 2012, 83(5), 586-597.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF5454-10mM	Apatinib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5454-5mg	Apatinib (VEGFR抑制剂)	5mg
SF5454-25mg	Apatinib (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