

Sunitinib Malate

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	52709ES50	50 mg
Sunitinib Malate	52709ES60	100 mg
	52709ES76	500 mg

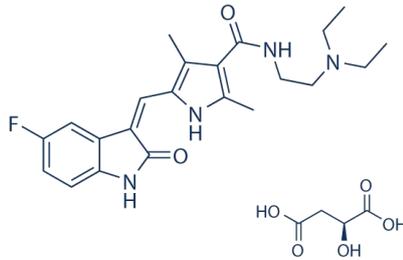
产品描述

Sunitinib Malate 是多靶点受体酪氨酸激酶(RTK)抑制剂, 抑制 VEGFR2 和 PDGFR β 活性, 无细胞实验中检测 IC₅₀ 值分别为 80 nM 和 2 nM。Sunitinib Malate 还会抑制 c-Kit 的活性, IC₅₀ 值为 211 nM。除此之外, Sunitinib Malate 还是一种有效的 ATP 竞争性抑制剂, 可通过抑制自身磷酸化和激活 RNase 来有效抑制 Ire1 α 的磷酸化, 达到有效抑制肿瘤细胞增殖, 诱导细胞凋亡的目的。

产品性质

英文别名 (English Name)	Sunitinib Malate
中文名称 (Chinese Name)	苹果酸苏尼替尼
CAS 号 (CAS NO.)	341031-54-7
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₂₇ FN ₄ O ₂ ·C ₄ H ₆ O ₅
分子量 (Molecular Weight)	532.56
外观 (Appearance)	橙黄色粉末
纯度 (Purity)	≥96%
溶解性 (Solubility)	易溶于 DMSO (15 mg/mL), 难溶于乙醇和 H ₂ O

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末-20 °C保存, 3 年有效; 4 °C保存, 2 年有效。储存液-80 °C保存, 6 个月有效; -20 °C保存, 1 个月有效。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

先将 RS4;11 细胞、MV4;11 细胞和 OC1-AML5 细胞接种培养基中，然后在含 0.1% FBS 的培养基上进行饥饿处理并过夜，加入不同浓度梯度的 Sunitinib Malate 和 FL (50 ng/mL; FLT3-WT) 孵育细胞 48 h 后，通过 Alamar Blue 检测或台盼蓝细胞活力检测测定增殖，发现 Sunitinib Malate 以剂量依赖的方式抑制 MV4;11 和 OC1-AML5 肿瘤细胞的增殖。同时加入 Sunitinib Malate 24 h 后，通过 Western blotting 测定发现，Sunitinib 明显抑制 caspase-3 水平的 PARP 分裂。^[2]

（二）体内实验（体内实验）

每天按大约 80 mg/kg 剂量的 Sunitinib Malate 试剂，口服处理多种移植瘤小鼠模型，包括 HT-29、A431、Colo205、H-460、SF763T、C6、A375 和 MDA-MB-435 肿瘤，持续 21 天。发现这八只鼠中有六只小鼠的肿瘤完全衰退，且在处理结束后的 110 天内，发现肿瘤没有复发。^[3]

参考文献

- [1] Sun L, et al. Discovery of 5-[5-fluoro-2-oxo-1,2-dihydroindol-(3Z)-ylidenemethyl]-2,4-dimethyl-1H-pyrrole-3-carboxylic acid (2-diethylaminoethyl)amide, a novel tyrosine kinase inhibitor targeting vascular endothelial and platelet-derived growth factor receptor tyrosine kinase. *J Med Chem*, 2003, 46 (7), 1116-1119.
- [2] O'Farrell AM, et al. SU11248 is a novel FLT3 tyrosine kinase inhibitor with potent activity in vitro and in vivo. *Blood*, 2003, 101(9), 3597-3605.
- [3] Mendel DB, et al. In vivo antitumor activity of SU11248, a novel tyrosine kinase inhibitor targeting vascular endothelial growth factor and platelet-derived growth factor receptors: determination of a pharmacokinetic/pharmacodynamic relationship. *Clin Cancer Res*, 2003, 9(1), 327-337.