



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **AXL-IN-13**
CAS 号: **2376928-82-2**
产品货号: **V38509**

生物活性:				
Description		AXL-IN-13 是一种有效的、具有口服活性的 AXL 抑制剂 (IC50: 1.6 nM, Kd : 0.26 nM)。AXL-IN-13 逆转 TGF-β1 诱导的上皮间质转化 (EMT), 并抑制癌细胞迁移和侵袭。		
IC50 & Target[1]		Axl	PDGFRβ 2.3 nM (Kd)	
Cellular Effect		Cell Line	Type	Value Description
		BaF3	IC50	4.7 nM Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells transfected with TEL-AXL assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs
In Vitro		AXL-IN-13 (化合物 6li) 抑制 Ba/F3-TEL-AXL 细胞增殖, IC50 为 4.7 nM (通过 ELISA 测定)[1].		
		AXL-IN-13 还显示对 CSF1R、FLT1/3/4、KLT、PDGFRB、TIE2 的结合亲和力[1]。		
		AXL-IN-13 (0-500 nM, 6 小时) 抑制 MDA-MB-231 和 4T1 细胞中 AXL 的磷酸化[1]。		
		AXL-IN-13 (0-3 μM, 3 天) 阻断 MDA-MB-231 细胞中 TGF- β 1 (10 ng/mL) 诱导的 EMT[1]。		
		AXL-IN-13 (0-3 μM, 24 小时) 抑制 TGF- β 1 (10 ng/mL) 诱导的 MDA-MB-231 细胞迁移和侵袭[1]。		
		Western Blot Analysis[1]		
		Cell Line:	MDA-MB-231 cells	
		Concentration:	0, 0.11, 0.33, 1, 3 μM.	
		Incubation Time:	3 days	
		Result:	Restored the protein levels of E-cadherin and N-cadherin to control levels.	
		Cell Migration Assay[1]		
		Cell Line:	MDA-MB-231 cell	
		Concentration:	0, 0.11, 0.33, 1, 3 μM.	
		Incubation Time:	24 h	
Result:	Inhibited cell migration at 1 and 3 μM. Inhibited the invasion of MDA-MB-231 cells by 22.6, 34.8, 56.5, and 70.4% at the concentrations of 0.11, 0.33, 1.0, and 3.0 μM, respectively..			
In Vivo		AXL-IN-13 (化合物 6li) (50 或 100 mg/kg, 口服, 14 天) 抑制 4T1 肿瘤生长和转移[1]。		
		AXL-IN-13 (25 mg/kg, 口服) 显示出较好的 PK 曲线, AUC 为 8410.21 ng/mL/h, T1/2 值为 4.22 h, 口服生物利用度 (F) 为 14.4%[1]。		
		Animal Model:	Xenograft model derived from highly metastatic 4T1 cells.[1]	
		Dosage:	50 or 100 mg/kg	
		Administration:	Oral administration (p.o.)	
		Result:	Suppressed 4T1 tumor growth with a tumor growth inhibition (TGI) of 78.0 and 95.9% at 50 and 100 mg/kg, respectively. Inhibited the phosphorylation of AXL.	



		Showed that liver is one of the most common sites of breast cancer metastasis.				
	Animal Model:	Rats[1]				
	Dosage:	5 mg/kg (i.v.), 25 mg/kg (p.o.)				
	Administration:	Intravenous injection (i.v.), oral administration (p.o.)				
	Result:	Pharmacokinetic parameters of AXL-IN-13 (Compound 6li).				
		parameters	T _{1/2} (h)	C _{max} (ng/mL)	AUC _{last}	F (%)
		5 mg/kg (i.v.)	3.31	12280.44	11684.24	
		25 mg/kg (p.o.)	4.22	887.75	8410.21	14.4

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (158.05 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.5805 mL	7.9024 mL	15.8048 mL
	5 mM	0.3161 mL	1.5805 mL	3.1610 mL
	10 mM	0.1580 mL	0.7902 mL	1.5805 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month. -80℃ 储存时, 请在 6 个月内使用, -20℃ 储存时, 请在 1 个月内使用。

动物实验:

请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。

以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂:
——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用;

以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶

方案 一

请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: 2.5 mg/mL (3.95 mM); 澄清溶液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。

生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。

方案 二

请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil

Solubility: 2.5 mg/mL (3.95 mM); 澄清溶液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Chan S, et al. Discovery of 3-Aminopyrazole Derivatives as New Potent and Orally Bioavailable AXL Inhibitors. J Med Chem. 2022 Nov 24;65(22):15374-15390.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.5805 mL	7.9024 mL	15.8048 mL	39.5120 mL
	5 mM	0.3161 mL	1.5805 mL	3.1610 mL	7.9024 mL
	10 mM	0.1580 mL	0.7902 mL	1.5805 mL	3.9512 mL
	15 mM	0.1054 mL	0.5268 mL	1.0537 mL	2.6341 mL
	20 mM	0.0790 mL	0.3951 mL	0.7902 mL	1.9756 mL
	25 mM	0.0632 mL	0.3161 mL	0.6322 mL	1.5805 mL
	30 mM	0.0527 mL	0.2634 mL	0.5268 mL	1.3171 mL
	40 mM	0.0395 mL	0.1976 mL	0.3951 mL	0.9878 mL
	50 mM	0.0316 mL	0.1580 mL	0.3161 mL	0.7902 mL
	60 mM	0.0263 mL	0.1317 mL	0.2634 mL	0.6585 mL
	80 mM	0.0198 mL	0.0988 mL	0.1976 mL	0.4939 mL
	100 mM	0.0158 mL	0.0790 mL	0.1580 mL	0.3951 mL