



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **ZD-4190**
CAS 号: **413599-62-9**
产品货号: **S88106**

生物活性:

Description	ZD-4190 是一种有效的, 可口服的 VEGFR2 和 EGFR 的抑制剂, 用于癌症研究。				
IC50 & Target	EGFR VEGFR2				
In Vitro	ZD4190 exhibits cytotoxic activity against the tumor cells[2]。				
In Vivo	ZD4190 (100 mg/kg, p.o.) effectively delays MDA-MB-435 tumor growth in mice. In ZD4190-treated tumors, 18F-FPPRGD2 uptake has decreased significantly relative to baseline by 26.74±8.12% (p<0.05) on day 1 and by 41.19±6.63% (p<0.01) on day 3, then has returned to baseline on day 7. Tumor uptake of 18F-FLT has also decreased on both day 1 and day 3 after initiation of ZD4190 treatment. However, ZD4190 does not significantly change 18F-FDG uptake in tumors, compared with the control group[1]. ZD4190 (50 mg/kg, p.o.) prevents outgrowth of residual tumour in a muscle model of minimal residual carcinoma[2]. ZD4190 (12.5-100 mg/kg, p.o.) produces a dose-dependent reduction in K(trans) in PC-3 prostate tumors. At 100 mg/kg, ZD4190 reduces K(trans) in PC-3 tumors by 31% following 2 doses and by 53% following 8 doses[3].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 20.83 mg/mL (45.35 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	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1774 mL	10.8868 mL	21.7737 mL
		5 mM	0.4355 mL	2.1774 mL	4.3547 mL
		10 mM	0.2177 mL	1.0887 mL	2.1774 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.53 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。					



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: shyyssw@sina.com

参考文献

- [1]. Yang M, et al. PET imaging of early response to the tyrosine kinase inhibitor ZD4190. Eur J Nucl Med Mol Imaging. 2011 Jul;38(7):1237-47. doi: 10.1007/s00259-011-1742-z. Epub 2011 Mar 1.
- [2]. Gaballah K, et al. The antiangiogenic agent ZD4190 prevents tumour outgrowth in a model of minimal residual carcinoma in deep tissues. Br J Cancer. 2009 Aug 4;101(3):418-23. doi: 10.1038/sj.bjc.6605092. Epub 2009 Jul 21.
- [3]. Checkley D, et al. Dynamic contrast-enhanced MRI of vascular changes induced by the VEGF-signalling inhibitor ZD4190 in human tumour xenografts. Magn Reson Imaging. 2003 Jun;21(5):475-82.

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, 2 years; -20° C, 1 year。 -80° C 储存时,请在 2 年内使用, -20° C 储存时,请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1774 mL	10.8868 mL	21.7737 mL	54.4342 mL
	5 mM	0.4355 mL	2.1774 mL	4.3547 mL	10.8868 mL
	10 mM	0.2177 mL	1.0887 mL	2.1774 mL	5.4434 mL
	15 mM	0.1452 mL	0.7258 mL	1.4516 mL	3.6289 mL
	20 mM	0.1089 mL	0.5443 mL	1.0887 mL	2.7217 mL
	25 mM	0.0871 mL	0.4355 mL	0.8709 mL	2.1774 mL
	30 mM	0.0726 mL	0.3629 mL	0.7258 mL	1.8145 mL
	40 mM	0.0544 mL	0.2722 mL	0.5443 mL	1.3609 mL