



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: **Sulfatinib**
CAS 号: **1816307-67-1**
产品货号: **S88511**

生物活性:

Description	Sulfatinib (Surufatinib) 是一种有效且高度选择性的针对 VEGFR1/2/3, FGFR1 和 CSF1R 的酪氨酸激酶抑制剂, IC50 值在 1 到 24 nM 之间。				
IC50 & Target[1]	VEGFR1	VEGFR2	VEGFR3	FGFR1	CSF1R
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HUVEC	IC ₅₀	< 50 nM	Antiproliferative activity against FGF stimulated HUVEC cells assessed as reduction in cell viability incubated for 72 hrs by MTT assay	
	HUVEC	IC ₅₀	< 50 nM	Antiproliferative activity against VEGF stimulated HUVEC cells assessed as reduction in cell viability incubated for 72 hrs by MTT assay	
In Vitro	SuLfatinib 抑制 VEGFR1、2 和 3、FGFR1 和 CSF1R 激酶, IC50 范围为 1 至 24 nM, 它强烈阻断 VEGF 诱导的 HEK293KDR 细胞中的 VEGFR2 磷酸化和 CSF1 刺激的 CSF1R 磷酸化 RAW264.7 细胞的 IC50 分别为 2 和 79 nM。SuLfatinib 还减弱 VEGF 或 FGF 刺激的 HUVEC 细胞增殖, IC50< 50 nM[1]。 此外, 它是一种 hERG 抑制剂, 在 CHO 细胞中的 IC50 为 6.8 μM[2]。				
In Vivo	在动物研究中, 单次口服 SuLfatinib 以暴露依赖性方式抑制裸鼠肺组织中 VEGF 刺激的 VEGFR2 磷酸化。此外, 给药后 24 小时血浆中 FGF23 水平的升高表明 FGFR 信号传导受到抑制。Sulfatinib 在多种人类异种移植模型中表现出有效的肿瘤生长抑制作用, 并显著降低 CD31 表达, 表明通过 VEGFR 和 FGFR 信号传导强烈抑制血管生成。在同源小鼠结肠癌模型 CT-26 中, Sulfatinib 在单药处理后表现出中度肿瘤生长抑制作用[1]。 口服给药 10 mg/kg 后, 小鼠的 AUC 和 Cmax 分别为 397 ng/mL 和 138ng/mL[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (208.08 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0808 mL	10.4041 mL	20.8082 mL
		5 mM	0.4162 mL	2.0808 mL	4.1616 mL
		10 mM	0.2081 mL	1.0404 mL	2.0808 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.33 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。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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 ddH₂O 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.33 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。 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 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.33 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。
参考文献	[1]. PCT Int. Appl. (2011), WO 2011060746 A1 20110526.

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	2.0808 mL	10.4041 mL	20.8082 mL	52.0205 mL
	5 mM	0.4162 mL	2.0808 mL	4.1616 mL	10.4041 mL
	10 mM	0.2081 mL	1.0404 mL	2.0808 mL	5.2020 mL
	15 mM	0.1387 mL	0.6936 mL	1.3872 mL	3.4680 mL
	20 mM	0.1040 mL	0.5202 mL	1.0404 mL	2.6010 mL



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

	25 mM	0.0832 mL	0.4162 mL	0.8323 mL	2.0808 mL
	30 mM	0.0694 mL	0.3468 mL	0.6936 mL	1.7340 mL
	40 mM	0.0520 mL	0.2601 mL	0.5202 mL	1.3005 mL
	50 mM	0.0416 mL	0.2081 mL	0.4162 mL	1.0404 mL
	60 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3468 mL	0.8670 mL
	80 mM	0.0260 mL	0.1301 mL	0.2601 mL	0.6503 mL
	100 mM	0.0208 mL	0.1040 mL	0.2081 mL	0.5202 mL



源叶