



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Zanzalintinib (Synonyms: XL092)**  
CAS 号: **2367004-54-2**  
产品货号: **S89224**

生物活性:

|                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
|------------------------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------|---------------|---------------|---------------|------------------------------|-------------------------------------|---------|------------------------------------|-----------------|------|-----------|-----------------------------------------------|------------|------|-----------|-----------|-----------|-------|-----------|-----------|-----------|
| Description                  | Zanzalintinib (XL092) 是一种口服有效的, ATP 竞争性的多受体酪氨酸激酶 (RTKs) 抑制剂, 包括 MET、VEGFR2、AXL 和 MER, 在细胞分析中的 IC50 值分别为 15 nM、1.6 nM、3.4 nM 和 7.2 nM。Zanzalintinib 具有抗肿瘤活性。Zanzalintinib 具有用于研究激酶依赖性疾病的潜力。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| IC50 & Target[1]             | Axl                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | Mer       | VEGFR2        | AXL           | MER           |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
|                              |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |           | 1.6 nM (IC50) | 3.4 nM (IC50) | 7.2 nM (IC50) |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| In Vivo                      | <p>Zanzalintinib (10 mg/kg/天; 口服; 持续 14 天) 在异种移植研究中引起显著的肿瘤生长抑制。Zanzalintinib 对 p-MET 和 p-VEGFR2 的抑制率分别为 82% 和 96%[1]。</p> <p>Zanzalintinib (化合物 8; 3 mg/kg; iv) 的 T1/2 为 5.4 小时, CL 为 43 mL/hr • kg。Zanzalintinib (3 mg/kg; 口服) 对大鼠的 T1/2 为 7.1 小时, Cmax 为 11.4 μM[2]。</p> <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Rat[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>3 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>IV</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Had a T1/2 of 5.4 hours, a CL of 43 mL/hr•kg.</td></tr></table>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |           |               |               |               | Animal Model:                | Rat[1]                              | Dosage: | 3 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis) | Administration: | IV   | Result:   | Had a T1/2 of 5.4 hours, a CL of 43 mL/hr•kg. |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| Animal Model:                | Rat[1]                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| Dosage:                      | 3 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| Administration:              | IV                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                      |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| Result:                      | Had a T1/2 of 5.4 hours, a CL of 43 mL/hr•kg.                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |           |               |               |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
| Solvent&Solubility           | <p><b>细胞实验:</b></p> <p>DMSO 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (31.54 mM); 超声助溶 (&lt;60° C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)</p> <table><tr><td rowspan="4">Preparing<br/>Stock Solutions</td><td><div>SolventMassConcentration</div></td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.8920 mL</td><td>9.4602 mL</td><td>18.9204 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.3784 mL</td><td>1.8920 mL</td><td>3.7841 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1892 mL</td><td>0.9460 mL</td><td>1.8920 mL</td></tr></table> <p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (protect from light)。-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。</p> <p><b>动物实验:</b></p> <p>请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。</p> <p>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:</p> <p>——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;</p> <p>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</p> <p>方案 一</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline</p> <p>Solubility: 2.5 mg/mL (4.73 mM); 悬浊液; 超声助溶</p> <p>此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p> <p>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。</p> |           |               |               |               | Preparing<br>Stock Solutions | <div>SolventMassConcentration</div> | 1 mg    | 5 mg                               | 10 mg           | 1 mM | 1.8920 mL | 9.4602 mL                                     | 18.9204 mL | 5 mM | 0.3784 mL | 1.8920 mL | 3.7841 mL | 10 mM | 0.1892 mL | 0.9460 mL | 1.8920 mL |
| Preparing<br>Stock Solutions | <div>SolventMassConcentration</div>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     | 1 mg      | 5 mg          | 10 mg         |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
|                              | 1 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 1.8920 mL | 9.4602 mL     | 18.9204 mL    |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
|                              | 5 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | 0.3784 mL | 1.8920 mL     | 3.7841 mL     |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |
|                              | 10 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   | 0.1892 mL | 0.9460 mL     | 1.8920 mL     |               |                              |                                     |         |                                    |                 |      |           |                                               |            |      |           |           |           |       |           |           |           |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.94 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>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。</p> <p>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.94 mM); 澄清溶液</p> <p>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。</p> <p>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。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. J. Hsu, et al. XL092, a multi-targeted inhibitor of MET, VEGFR2, AXL and MER with an optimized pharmacokinetic profile. European Journal of Cancer, Volume 138, Supplement 2, October 2020, Page S16.</p> <p>[2]. Lynne Canne Bannen, et al. Compounds for the treatment of kinase-dependent disorders.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |

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 (protect from light)。-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 | <div>质量<br/>溶剂体积<br/>浓度</div> | 1 mg      | 5 mg      | 10 mg      | 25 mg      |
|------|-------------------------------|-----------|-----------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM                          | 1.8920 mL | 9.4602 mL | 18.9204 mL | 47.3010 mL |
|      | 5 mM                          | 0.3784 mL | 1.8920 mL | 3.7841 mL  | 9.4602 mL  |
|      | 10 mM                         | 0.1892 mL | 0.9460 mL | 1.8920 mL  | 4.7301 mL  |
|      | 15 mM                         | 0.1261 mL | 0.6307 mL | 1.2614 mL  | 3.1534 mL  |
|      | 20 mM                         | 0.0946 mL | 0.4730 mL | 0.9460 mL  | 2.3651 mL  |
|      | 25 mM                         | 0.0757 mL | 0.3784 mL | 0.7568 mL  | 1.8920 mL  |
|      | 30 mM                         | 0.0631 mL | 0.3153 mL | 0.6307 mL  | 1.5767 mL  |