

Sorafenib Tosylate

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Sorafenib Tosylate	52012ES08	5 mg
Sorafenib Tosylate	52012ES10	10 mg
Sorafenib Tosylate	52012ES50	50 mg

产品描述

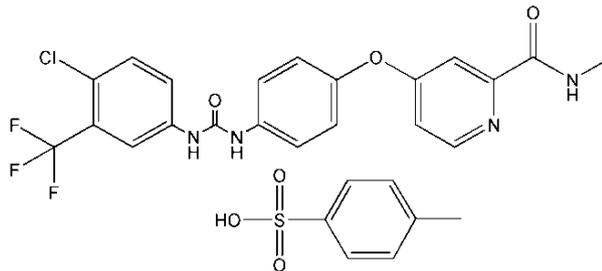
Sorafenib Tosylate 又称 Sorafenib p-Toluenesulfonate, BAY 54-9085, 有效抑制 Raf kinases, Raf-1 (IC₅₀=6 nM)、 wt BRAF (IC₅₀=22 nM)和 V599E 突变的 BRAF (IC₅₀=38 nM)和 VEGFR2 (IC₅₀=90 nM (人)、15 nM (鼠))。Sorafenib 具有广泛的抗肿瘤活性, 在结肠癌, 乳腺癌和非小细胞肺癌移植瘤模型中抑制肿瘤细胞增殖和肿瘤生长。Sorafenib 抑制 MEK 和 ERK 磷酸化, 并下调 PLC/PRF/5 和 HepG2 细胞中细胞周期蛋白 D1 的浓度。另外, sorafenib 还可以降低 eIF4E 磷酸化水平并下调细胞凋亡蛋白 Mcl-1 的浓度, 其作用方式不依赖 MEK/ERK。

Sorafenib p-Toluenesulfonate 是已售药物 Nexavar®的有效成分, 已被批准用于晚期肾癌和肝细胞癌的治疗。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Sorafenib p-Toluenesulfonate, Nexavar®, BAY 43-9006 2-Pyridinecarboxamide,
化学名 (Chemical Name)	4-[4-[[[4-chloro-3-(trifluoromethyl)phenyl]amino]carbonyl]amino]phenoxy]-N-methyl-, 4-methylbenzenesulfonate (1:1)
靶点 (Target)	Raf kinases/VEGFR
CAS 号 (CAS NO.)	475207-59-1
分子式 (Molecular Formula)	C ₂₁ H ₁₆ ClF ₃ N ₄ O ₃ •C ₇ H ₈ O ₃ S
分子量 (Molecular Weight)	637.03
外观 (Appearance)	黄色或类白色结晶粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (50 mg/mL)

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于-20°C, 有效期2年。易溶于DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放6个月。

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) 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。
- 4) 本产品仅作科研用途！

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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

- 1) Sorafenib Tosylate (BAY 43-9006) 有效抑制 Raf-1 ($IC_{50}=6$ nmol/L), wt BRAF ($IC_{50}=22$ nmol/L), V599E mutant BRAF ($IC_{50}=38$ nmol/L)。^[1]
- 2) 为检测 sorafenib 对细胞增殖的作用，用 0-10 μ M sorafenib 孵育 PLC/PRF/5 和 HepG2 细胞 72 h, Sorafenib 以剂量依赖的方式抑制细胞增殖，其 IC_{50} 值分别为 6.3 μ mol/L 和 4.5 μ mol/L。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

- 1) 在体内实验中，建立多种移植瘤小鼠模型，如 MDA-MB-231, Colo-205, HT-29, DLD-1, NCI-H460 和 A549 等，给小鼠每天口服 7.5, 15, 30 和 60 mg/kg Sorafenib Tosylate (BAY 43-9006)，持续 9 天。发现，Sorafenib 以剂量依赖的方式抑制肿瘤生长，而且没有明显的细胞毒性。在 HT-29, Colo-205 和 DLD-1 人结肠癌肿瘤模型及 A549 NSCLC 模型中，30 和 60 mg/kg sorafenib 可以完全抑制肿瘤生长。^[1]
- 2) 建立 PLC/PRF/5 移植瘤小鼠模型，小鼠口服 10, 30, 100 mg/kg sorafenib tosylate, Sorafenib 表现出剂量依赖的抑制肿瘤生长作用，10 和 30 mg/kg sorafenib tosylate 时，TGIs 分别为 49% 和 78%。在 100 mg/kg 剂量时，在 50%小鼠体内产生持久的肿瘤衰退。另外，在实验模型中没有检测到致命性作用。^[2]

参考文献

- [1] Wilhelm SM, et al. BAY 43-9006 Exhibits Broad Spectrum Oral Antitumor Activity and Targets the RAF/MEK/ERK Pathway and Receptor Tyrosine Kinases Involved in Tumor Progression and Angiogenesis. *Cancer Res.* 64: 7099-7109 (2004).
- [2] Li Liu, et al. Sorafenib Blocks the RAF/MEK/ERK Pathway, Inhibits Tumor Angiogenesis, and Induces Tumor Cell Apoptosis in Hepatocellular Carcinoma Model PLC/PRF/5. *Cancer Res* 66: 11851-11858(2006).