

Apatinib mesylate

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Apatinib mesylate	53715ES08	5 mg
	53715ES10	10 mg

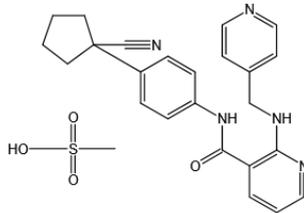
产品描述

Apatinib mesylate (YN968D1, Rivoceranib), 又称甲磺酸阿帕替尼或艾坦, 是一种可口服的 VEGF2 抑制剂, IC₅₀ 值分别为 1 nM, 阻断 VEGF2 下游信号传导, 具有潜在的抗血管生成和抗肿瘤活性, 临床是用于治疗转移性胃癌。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Apatinib mesylate, YN968D1, Rivoceranib
中文名称 (Chinese Name)	甲磺酸阿帕替尼, 艾坦
靶点 (Target)	VEGFR2
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--VEGFR
CAS 号 (CAS NO.)	1218779-75-9
分子式 (Formula)	C ₂₅ H ₂₇ N ₅ O ₄ S
分子量 (Molecular Weight)	493.58
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

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。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

（一）细胞实验（体外实验）

Apatinib (25 μ M)抑制 FBS 诱导的 HUVEC 细胞的增殖、迁移和心管形成。^[1] Apatinib 作用于 ABCB1 或 ABCG2 过表达的细胞，显著增加形成的 ABCB1 和 ABCG2 底物的细胞毒性，并增加了 DOX 和 Rho 123 的累积。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在 Ls174t、HCT 116、SGC-7901、HT-29、A549、NCI-H460 移植瘤小鼠模型中，Apatinib (50-200 mg/kg)抑制多种人类移植瘤的生长，这种作用具有剂量依赖性。^[1] Apatinib 作用于携带 K562/ADR 移植瘤的裸鼠，显著增强 Doxorubicin 的抗肿瘤活性。^[3]

参考文献

- [1]. Tian S, et al, et al. YN968D1 is a novel and selective inhibitor of vascular endothelial growth factor receptor-2 tyrosine kinase with potent activity in vitro and in vivo. *Cancer Sci.* 2011 Jul;102(7):1374-80.
- [2]. Mi YJ, et al. Apatinib (YN968D1) reverses multidrug resistance by inhibiting the efflux function of multiple ATP-binding cassette transporters. *Cancer Res.* 2010 Oct 15;70(20):7981-91.
- [3]. Tong XZ, et al. Apatinib (YN968D1) enhances the efficacy of conventional chemotherapeutic drugs in side population cells and ABCB1-overexpressing leukemia cells. *Biochem Pharmacol.* 2012 Mar 1;83(5):586-97.