

Motesanib Diphosphate (AMG706)

产品信息

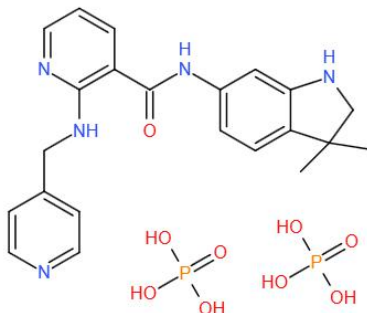
产品名称	产品编号	规格
Motesanib Diphosphate (AMG706)	52707ES08	5 mg
	52707ES10	10 mg
	52707ES50	50 mg

产品描述

Motesanib Diphosphate (AMG-706)是一种有效的、可口服的、ATP 竞争型的多受体酪氨酸激酶抑制剂，对 VEGFR1/2/3 的 IC₅₀ 值分别为 2 nM/3 nM/6 nM，对 Kit (c-Kit)具有相似的抑制活性，具有潜在抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AMG 706; AMG-706; Motesanib
中文名称 (Chinese Name)	二磷酸莫特塞尼; 莫替沙尼; 二磷酸莫替沙尼
靶点 (Target)	VEGFR1; VEGFR2; VEGFR3; c-Kit
CAS 号 (CAS NO.)	857876-30-3
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₂₃ N ₅ O·2H ₃ PO ₄
分子量 (Molecular Weight)	569.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: 90 mg/mL(158 mM, 需加热处理)
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃，有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20℃避光保存，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) 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）

Motesanib Diphosphate (AMG706)对人 VEGFR 家族具有广谱活性，并对 EGFR、Src 和 p38 激酶表现出超过 1000 倍的选择性。Motesanib Diphosphate 显著抑制 VEGF 诱导的 HUVECs 细胞增殖， IC_{50} 值是 10 nM，而对 BFGF 诱导的 HUVECs 细胞增殖的影响很小，其 IC_{50} 值大于 3000 nM。Motesanib Diphosphate 也能有效抑制 PDGF 诱导的细胞增殖和 SCF 诱导的 c-kit 磷酸化，其 IC_{50} 值分别为 207 nM 和 37 nM，但对 EGF 诱导的 EGFR 磷酸化和 A431 细胞活力无效。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

Motesanib Diphosphate (100 mg/kg; 口服给药) 处理大鼠角膜模型，每日 2 次或每日 1 次口服治疗，结果显示 Motesanib Diphosphate 以时间依赖性方式显著抑制 VEGF 诱导的血管通透性，其 ED_{50} 值分别为 2.1 mg/kg 和 4.9 mg/kg。Motesanib Diphosphate (AMG706)可有效抑制 VEGF 诱导的血管生成。^[1]

参考文献

- [1]. Polverino A, et al. AMG 706, an oral, multikinase inhibitor that selectively targets vascular endothelial growth factor, platelet-derived growth factor, and kit receptors, potently inhibits angiogenesis and induces regression in tumor xenografts. *Cancer Res.* 2006 Sep 1;66(17):8715-21.
- [2]. Coxon A, et al. Broad antitumor activity in breast cancer xenografts by motesanib, a highly selective, oral inhibitor of vascular endothelial growth factor, platelet-derived growth factor, and Kit receptors. *Clin Cancer Res*, 2009, 15(1), 110-118.