

HB220119

Everolimus (RAD001; SDZ-RAD; 依维莫司)

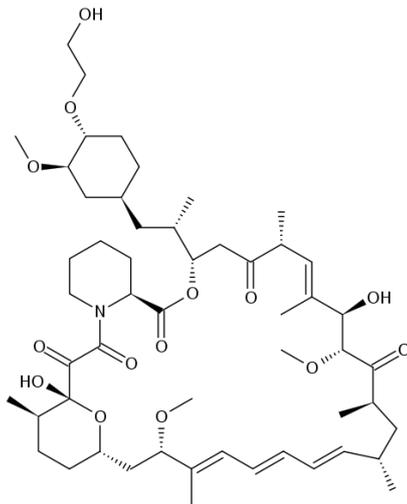
产品信息

产品名称	产品编号	规格
Everolimus (RAD001; SDZ-RAD; 依维莫司)	52411ES08	5 mg
	52411ES25	25 mg

产品描述

Everolimus (也称为 RAD001; SDZ-RAD; Afinitor; Certican; Zortress) 是 rapamycin (sirolimus) 的 40-O-(2-羟乙基) 衍生物, 作用机制类似 rapamycin 靶向抑制 mTOR 活性, 表现出免疫抑制剂和抗血管生成特性。Everolimus 竞争性结合 FKBP12 ($IC_{50}=1.8-2.6$ nM), 从而抑制 p70 S6 激酶活化, 进而阻断生长因子介导的 T 细胞、B 细胞和 VSMC 细胞增殖, 促使细胞周期停滞在 G1 期。Everolimus 抑制多种体外培养人肿瘤细胞系和体内动物移植瘤的增殖。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Certican; Zortress; Afinitor; RAD001; SDZ-RAD; RAD 001; RAD-001
中文名称 (Chinese Name)	依维莫司
靶点 (Target)	FKBP12
CAS 号 (CAS NO.)	159351-69-6
分子式 (Formula)	$C_{53}H_{83}NO_{14}$
分子量 (Molecular Weight)	958.22
外观 (Appearance)	白色或类白色粉末
纯度 (Purity)	$\geq 95\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: 50 mg/mL (52.2 mM)
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 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 -20°C 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）

Everolimus (0.1 mg/kg-10 mg/kg) 呈剂量依赖性的抑制 B16/BL6 黑色素瘤的原代生长、淋巴结转移和血管生成。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

Everolimus (0.5 mg/kg/d, 2.5 mg/kg/d; 口服给药; 每周 6 次或 5 mg/kg; 口服给药; 每周 1-2 次) 处理移植了 CA20948 肿瘤的雄性 Lewis 鼠，发现 Everolimus 显著抑制肿瘤生长，表现出抗肿瘤活性，并且没有明显的体重减少也没有死亡。^[2]

参考文献

- [1]. Lane HA, et al. mTOR inhibitor RAD001 (everolimus) has antiangiogenic/vascular properties distinct from a VEGFR tyrosine kinase inhibitor. *Clin Cancer Res.* 2009 Mar 1;15(5):1612-22.
- [2]. O'Reilly T, et al. Biomarker Development for the Clinical Activity of the mTOR Inhibitor Everolimus (RAD001): Processes, Limitations, and Further Proposals. *Transl Oncol.* 2010 Apr;3(2):65-79.