

Cabozantinib 卡博替尼

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Cabozantinib 卡博替尼	52724ES08	5 mg
	52724ES25	25 mg

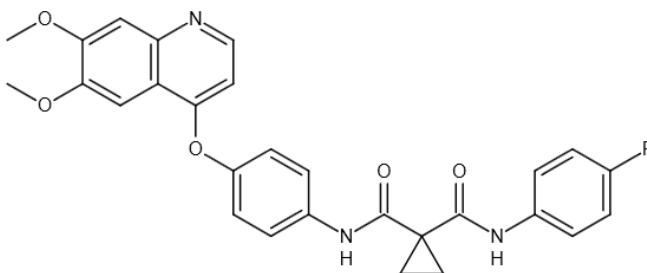
产品描述

Cabozantinib (BMS-907351, BMS907351, XL-184, XL184)是多种受体酪氨酸激酶小分子抑制剂, 尤其抑制 c-Met 和 VEGFR2 表达水平, 其 IC₅₀ 值分别为 1.3 nM 和 0.035 nM。Cabozantinib 也作用于 Ret、Kit、Flt-1/3/4、Tie2 和 AXL, 其 IC₅₀ 值分别为 4 nM、4.6 nM、12 nM/11.3 nM/6 nM、14.3 nM 和 7 nM。Cabozantinib 可用于转移甲状腺髓样癌(MTC)的治疗, 降低肿瘤增殖, 抑制肿瘤生长。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	BMS-907351; BMS907351; BMS 907351; XL-184; XL184; XL 184
中文名称 (Chinese Name)	卡博替尼
靶点 (Target)	c-Met; Ret; Kit; Flt-1/3/4; Tie2; AXL
CAS 号 (CAS NO.)	849217-68-1
分子式 (Formula)	C ₂₈ H ₂₄ FN ₃ O ₅
分子量 (Molecular Weight)	501.52
外观 (Appearance)	白色粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	易溶于 DMSO, 难溶于乙醇和 H ₂ O

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 3 年; 保存于 4℃, 有效期 2 年。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. 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）

使用 0~10 μM 浓度梯度的 Cabozantinib 处理 MPNST724 细胞，通过 MTS 实验测定细胞生长状况，然后在 490 nm 处测定吸光值。发现低浓度 Cabozantinib (0.1-0.5 μM) 也显著抑制 MPNST 细胞组成型和诱导型 Met 磷酸化及其下游信号，同时发现 Cabozantinib 浓度为 0.1 μM 时不能抑制 MPNST 细胞生长，但是浓度为 5-10 μM 时则能显著抑制 MPNST 细胞生长。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

Cabozantinib (60 mg/kg)，每天一次，口服饲喂携带自发胰岛肿瘤的 RIP-TAG2 转基因小鼠模型。一段时间后，发现 Cabozantinib 抑制肿瘤生长，并且呈现剂量依赖性。^[1] Cabozantinib (100 mg/kg, 10 mg/kg) 分别单独处理携带 MDA-MB-231 肿瘤的小鼠和携带 C6 肿瘤的大鼠模型，发现肿瘤生长被持续抑制，且肿瘤长时间未复发。^[3]

参考文献

- [1]. You WK, et al. VEGF and c-Met blockade amplify angiogenesis inhibition in pancreatic islet cancer. *Cancer Res*, 2011, 71(14), 4758-4768.
- [2]. Torres KE, et al. Activated MET is a molecular prognosticator and potential therapeutic target for malignant peripheral nerve sheath tumors. *Clin Cancer Res*, 2011, 17(12), 3943-3955.
- [3]. Yakes FM, et al. Cabozantinib (XL184), a novel MET and VEGFR2 inhibitor, simultaneously suppresses metastasis, angiogenesis, and tumor growth. *Mol Cancer Ther*, 2011, 10(12), 2298-2308.