

Regorafenib

产品编号: D50430

CAS: 755037-03-7

保存条件: Store at -20°C.

产品介绍: CAS号: 755037-03-7

分子式: C₂₁H₁₅ClF₄N₄O₃

分子量: 482.82

MDL: MFCD1603804

纯度: ≥98%(HPLC)

外观/性状: 白色结晶粉末

溶解性: DMSO ≥95mg/mL; Water <1 mg/mL; Ethanol <1 mg/mL

作用靶点: VEGFR; Autophagy; PDGFR; Raf; RET;

作用通路: Protein Tyrosine Kinase/RTK; Autophagy; MAPK/ERK Pathway;

产品描述: 瑞格非尼 (Regorafenib)是一个多靶点抑制剂, 作用

于VEGFR1, VEGFR2, VEGFR3, PDGFR-β, Kit, RET和Raf-1, 在无细胞试验中IC₅₀分别是13 nM, 4.2 nM, 46 nM, 22 nM, 7 nM, 1.5 nM和2.5 nM。

体外研究: 在 NIH-3T3细胞中 Regorafenib 强烈抑制 VEGFR2的 自磷酸化, IC₅₀ 为3 nM.

在HAoSMCs中, Regorafenib 抑制 PDGFR-β经过PDGF-BB刺激后的自磷酸化, IC₅₀ 为90 nM.

在MCF-7 乳腺癌细胞中, Regorafenib 也会抑制FGF10刺激后 FGFR 的信号传导. Regorafenib 非常有效的抑制KITK642E 和 RETC634W这两个突变的受体, IC₅₀ 分别是大约 20 nM 和 10 nM. Regorafenib 抑制经过VEGF165 刺激后的 HUVECs细胞的增值, IC₅₀ 为 大约 3 nM.

Regorafenib抑制 FGF2刺激后的 HUVECs和PDGF-BB刺激后的HAoSMCs细胞的增殖, IC₅₀分别是127 nM 和 146 nM. Regorafenib通过抑制酪氨酸激酶受体(VEGFR, KIT, RET, FGFR和 PDGFR)和丝氨酸/苏氨酸激酶受体(RAF 和 p38MAPK)来靶向作用于肿瘤细胞增殖和肿瘤脉管系统。Regorafenib以浓度依赖和时间依赖方式抑制 人Hep3B, PLC/PRF/5 和 HepG2 细胞的生长。