

产品名称：SKLB1002  
产品别名：SKLB1002

生物活性:

Description	SKLB1002 是一种与 ATP 竞争的强效 VEGFR2 抑制剂，其 IC50 为 32 nM.				
IC50 & Target	VEGFR2 [1]				
	32 nM				
In Vitro	SKLB1002 对正常人细胞 L-02 表现出显著降低的细胞毒性。通过抑制 VEGF 诱导的 VEGFR2 激酶磷酸化和下游蛋白激酶，包括 ERK, FAK, 和 Src , SKLB1002 显著抑制 HUVEC 增殖，迁移，侵袭和管腔形成。[1]				
In Vivo	在斑马鱼胚胎中，SKLB1002 显著阻断胚胎形成和肿瘤诱导的血管生成，对正常细胞增殖没有影响或影响很小。在 SW620 或 HepG2 异种移植的无胸腺小鼠体内，SKLB1002 (100 毫克/千克 每天，腹腔注射)引起显著的肿瘤生长抑制，抑制肿瘤血管生成，并诱导肿瘤细胞凋亡。[1]在 4T1 和 CT26 肿瘤模型中，SKLB1002 和局部热疗产生协同的促进抗肿瘤血管生成，抗癌和细胞凋亡作用。[2]				
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b> <b>DMSO :4 mg/mL (12.48 mM)</b> <b>Water: Insoluble</b> <b>Ethanol: Insoluble</b>				
	Preparing  Stock Solutions	<div><div>Solvent    Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.1212 mL	15.6060 mL	31.2120 mL
		5 mM	0.6242 mL	3.1212 mL	6.2424 mL
		10 mM	0.3121 mL	1.5606 mL	3.1212 mL
	<p>*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。</p> <p>储备液的保存方式和期限 -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。</p>				
References	<p>[1] Zhang S, et al. Clin Cancer Res. 2011, 17(13), 4439-4450.</p> <p>[2] Nie W, et al. 2012. Doi 10.1007/s10238-012-0225-2.</p>				
实验参考:					
Cell Assay	<p><b>细胞实验:</b> [1]</p> <p><b>Cell lines:</b> HUVECs, L-02, B16-F10, HepG2, 和 SW620 细胞。</p> <p><b>Concentrations:</b> ~40 μM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 24 小时</p> <p><b>Method:</b> 细胞增殖采用 MTT 法检测。包括 HUVECs, L-02, B16-F10, HepG2, 和 SW620 的各种细胞用指示浓度的 SKLB1002 处理 24 小时。Vandetanib 和 sunitinib 作为阳性对照。每个测定重复进行 3 次。</p>				
Animal Administration	<p><b>动物实验:</b> [1]</p> <p><b>Animal Models:</b> 负荷 SW620 或 HepG2 肿瘤的小鼠。</p> <p><b>Formulation:</b> 含有 5% (v/v) DMSO 的 35% (v/v) 聚乙二醇溶液</p> <p><b>Dosages:</b> ~100 毫克/千克，每天</p> <p><b>Administration:</b> 腹腔注射</p>				
	<p><b>激酶抑制试验:</b> [1]</p>				

<b>Kinase Assay</b>	<p>激酶抑制通过激酶分析法使用放射性测量试验测定。简而言之，SKLB1002 存在或不存在下，VGFR2 (5–10 mU)在 25 微升反应液中培育，反应液包含 8 mmol/L 3-(N-吗啉代) 丙磺酸(MOPS), pH 7.0, 02 mmol/L EDTA, 0.33 毫克/毫升髓鞘碱性蛋白, 10 mmol/L Mg 醋酸盐, 和 <math>\gamma</math>-[<math>^{33}\text{P}</math>]ATP。室温下培育 40 分钟后，停止反应，然后将 10 微升反应液点样到 P30 滤垫上，在 75 mmol/L 磷酸中洗涤 3 次，在甲醇中洗涤 1 次，每次进行 5 分钟，然后进行闪烁计数。</p>
<b>References</b>	<p>[1] Zhang S, et al. Clin Cancer Res. 2011, 17(13), 4439-4450.</p> <p>[2] Nie W, et al. 2012. Doi 10.1007/s10238-012-0225-2.</p>



源叶生物