

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 IC ₅₀ 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	In Vitro: DMSO :4 mg/mL (12.48 mM) Water: Insoluble Ethanol: Insoluble				
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	3.1212 mL	15.6060 mL	31.2120 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.6242 mL	3.1212 mL	6.2424 mL
		10 mM	0.3121 mL	1.5606 mL	3.1212 mL
*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。 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。					
References	[1] Zhang S, et al. Clin Cancer Res. 2011, 17(13), 4439-4450. [2] Nie W, et al. 2012. Doi 10.1007/s10238-012-0225-2.				
实验参考:					
Cell Assay	细胞实验: [1] Cell lines: HUVECs, L-02, B16-F10, HepG2, 和 SW620 细胞。 Concentrations: ~40 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 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。				
Animal Administration	动物实验: [1] Animal Models: 负荷 SW620 或 HepG2 肿瘤的小鼠。 Formulation: 含有 5% (v/v) DMSO 的 35% (v/v) 聚乙二醇溶液 Dosages: ~100 毫克/千克, 每天 Administration: 腹腔注射				
	激酶抑制试验: [1]				

Kinase Assay	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, 0.2 mmol/L EDTA, 0.33 毫克/毫升鞘碱性蛋白, 10 mmol/L Mg 醋酸盐, 和 γ -[³³ P]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。
References	[1] Zhang S. et al. Clin Cancer Res. 2011, 17(13), 4439-4450. [2] Nie W. et al. 2012. Doi 10.1007/s10238-012-0225-2.



源叶生物