KRN 633；KRN-633；KRN633

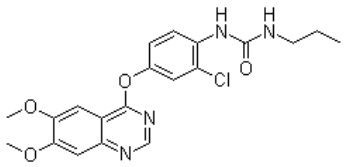
产品编号：MB3920

质量标准：>98%，ATP 竞争性 VEGFR1/2/3 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C20H21ClN4O4	结构式	
分子量	416.86		
CAS No.	286370-15-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：9 mg/mL (21.58 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：KRN-633 是 VEGFR 的有效抑制剂，作用于 VEGFR1，VEGFR2 和 VEGFR3。

别名：KRN 633; KRN633; N-[2-Chloro-4-[(6,7-dimethoxy-4-quinazolinyl)oxy]phenyl]-N'-propyl-urea

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：9 mg/mL (21.58 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	KRN 633 是 ATP 竞争性的 VEGFR1/2/3 抑制剂，IC50 为 170 nM/160 nM/125 nM, 微弱抑制 PDGFR-α/β和 c-Kit, 对细胞中 FGFR-1, EGFR 和 c-Met 的磷酸化没有抑制作用。				
靶点	VEGFR-1	VEGFR-2	VEGFR-3	PDGFRα	c-Kit
IC50	170 nM	160 nM	125 nM	965 nM	4330 nM

体外研究	KRN 633 是新型喹唑啉尿素衍生物, 强抑制 VEGFR-1, VEGFR-2 和 VEGFR-3，IC50 分别为 170 nM,160 nM 和 125 nM,对非受体酪氨酸激酶, 如 PDGF 受体(PDGFR)-α和-β,c-Kit, 乳腺肿瘤激酶,及内膜内皮细胞激酶酪氨酸激酶的抑制效果不明显， IC50 分别为 965, 9,850, 4,330, 9,200, 和 9,900 nM。KRN 633 作用于 HUVECs，有效抑制配体 VEGF 诱导的 VEGFR-2 磷酸化，IC50 为 1.16 nM。KRN 633 作用于内皮细胞，抑制 VEGF 依赖的,但是非 bFGF 依赖的 MAP 激酶磷酸化,作用于 ERK1 和 ERK2，IC50 分别为 3.51 nM 和 6.08 nM。KRN 633 抑制 VEGF 驱动的 HUVECs 增殖，IC50 为 14.9 nM, 3 μM KRN633 只稍微阻断 FGF 驱动的增殖。KRN 633 通过抑制 Akt 和 ERK 磷酸化信号通路而抑制低氧诱导的 HIF-1α转录激活，这种作用存在浓度依赖性，IC50 为 3.79 μM。
体内研究	虽然 KRN633 在体外对多种癌细胞没有毒性，但是在体内，KRN633 具有较强抗癌活性，因为其在肿瘤血管形成和血管渗透性方面的抑制效果。KRN633 按 100 mg/kg 剂量每天处理 A549,LC-6-LCK,HT29,Ls174T,LNCap 和 Du145 细胞, 明显抑制肿瘤生长，按 100 mg/kg 剂量每天处理两次 HT29 肿瘤，肿瘤生长抑制率达~90%。KRN 633 按 300 mg/kg 剂量口服给药妊娠中期小鼠，降低供应到胎儿组织的血量，因为胎盘和胎儿器官中血管形成减少，因此，提高诱导胎儿宫内生长限制(IUGR)的风险。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB5631	AV-951
MB4527	BFH772
MB3946	BMS-794833

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3989 mL	11.9944 mL	23.9889 mL
5 mM	0.4798 mL	2.3989 mL	4.7978 mL
10 mM	0.2399 mL	1.1994 mL	2.3989 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	**无细胞激酶实验:** 进行无细胞激酶实验获得作用于多种重组 VEGF 受体的 IC50 值。实验所用 KRN633 为 0.3 nM 到 10 μM，实验使用 1 μM ATP，所用实验重复做四次。
细胞实验	**Cell lines:** A549, Ls174T, DU145, HT29, LNCap 和 PC-3 细胞系 **Concentrations:** 溶于 DMSO, 终浓度为 0.01 到 10 μM **Incubation Time:** 96 小时 **Method:** 癌细胞接种在含 10% FBS 和抗生素的培养基中, 接种密度以实验期间能正常生长为准。细胞培养 24 小时，然后加入 KRN633(0.01 到 10 μM)，对照组为 0.1% DMSO ，然后再培养 96 小时。使用 WST-1 试剂测定细胞活力。
动物实验	**Animal Models:** 携带 A549,Ls174T,HT29,DU145,LNCap,PC-3 细胞的 BALB/cA,Jcl-nu 无胸腺小鼠，携带 LC-6-JCK 细胞的 F344/N,Jcl-rnu 无胸腺大鼠 **Formulation:** 在溶于蒸馏水的 0.5%甲基纤维素中配制 **Dosages:** 20-100 mg/kg **Administration:** 饲喂处理，每天一次

【注意】

●我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。

●部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 **产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。 如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度<0.3%,以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确

保 DMSO 的终浓度<5%,以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表
动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。
产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。
对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。