

## Ki8751

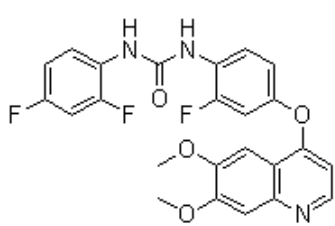
产品编号：MB3945

质量标准：>98%，选择性 VEGFR2 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C24H18F3N3O4	结 构 式	
分子量	469.41		
CAS No.	228559-41-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 47 mg/mL (100.12 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：**Ki8751 是有效地 VEGFR2 抑制剂。

**别名：**Urea, N-(2,4-difluorophenyl)-N'-[4-[(6,7-dimethoxy-4-quinolinyl)oxy]-2-fluorophenyl]-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 47 mg/mL (100.12 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Ki8751 是有效的，选择性 VEGFR2 抑制剂，IC50 为 0.9 nM，作用于 VEGFR2 比作用于 c-Kit, PDGFRα 和 FGFR-2 选择性高 40 倍以上，对 EGFR, HGFR 和 InsR 没有抑制活性。		
<b>靶点</b>	VEGFR-2	PDGFRα	c-Kit
<b>IC50</b>	0.9 nM	67 nM	40 nM
<b>体外研究</b>	Ki8751 有效且选择性抑制 VEGFR-2，IC50 为 0.9 nM。Ki8751 也抑制 PDGFRα, c-Kit, 和 FGFR-2, 具有更高的 IC50 值(40 nM-170 nM)。除了以上激酶，Ki8751 不会抑制其他激		

	酶, 包括 HGFR, EGFR, 和 InsulinR, 即使浓度为 10 $\mu$ M。1 nM–100 nM Ki8751 作用于人类人脐静脉内皮细胞(HUVECs), Ki8751(1 nM–100 nM) 有效降低 VEGF 刺激的细胞增殖和血管通透性。10 nM Ki8751 作用于转移性结肠直肠癌(CRC) 细胞 MIP, RKO, SW620, 和 SW480, 而不是 HCT116, 促进细胞衰老。
<b>体内研究</b>	Ki8751 按 20 mg/kg 剂量作用于携带 GL07, St-4, LC6, DLD-1, 和 A375 人类移植瘤的小鼠, 抑制肿瘤生长。Ki8751 按 5 mg/kg 剂量作用于携带 LC-6 移植瘤的裸鼠, 完全抑制肿瘤生长, 且不影响鼠体重。
<b>特征</b>	Ki8751 是新型有效的血管内皮生长因子受体-2 (VEGFR-2) 选择性抑制剂。

### 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)

MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3996	SAR131675
MB3944	Semaxanib (SU5416)

**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。Ki8751 是有效地 VEGFR2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1303 mL	10.6517 mL	21.3033 mL
5 mM	0.4261 mL	2.1303 mL	4.2607 mL
10 mM	0.2130 mL	1.0652 mL	2.1303 mL
50 mM	0.0426 mL	0.2130 mL	0.4261 mL

### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验:</b>	<p><b>细胞激酶实验:</b></p> <p>通过转染人类 KDR 获得 NIH3T3 细胞。细胞按每孔 <math>1.5 \times 10^4</math> 个培养在 I 型胶原包被的 96 孔板上。用含 0.1% FCS 的 DMEM 培养基更换原来培养基。Ki8751 在 DMSO 中稀释, 加到每孔中, 然后培养。加入 rhVEGF, 终浓度为 100 ng/mL, 在 37°C 下对细胞进行刺激处理。用 PBS(pH 7.4) 冲洗细胞, 加入 50 <math>\mu</math>L 溶酶缓冲液 (20 mM HEPES (pH 7.4), 150 mM NaCl, 0.2% Triton X-100, 10% 甘油, 5 mM <math>\text{Na}_3\text{VO}_4</math>, 5 mM 乙二胺四乙酸钠, 和 2 mM <math>\text{Na}_4\text{P}_2\text{O}_7</math>), 制备细胞抽提物。另外, 50 <math>\mu</math>L 含 5 <math>\mu</math>g/mL 抗磷酸酪氨酸抗体(PY20)的 PBS (pH 7.4) 加到孔板上, 用于进行 ELISA。板冲洗后, 加入 300 <math>\mu</math>L 阻断溶液。然后细胞抽提物</p>
--------------	--

	<p>转移到板上。加入 anti-VEGFR-2 抗体和过氧化物酶标记的兔免疫球蛋白抗日。加入过氧化物酶的显色底物，使用读数板在 450 nm 处测定吸光值。测定每孔的 VEGFR-2 磷酸化活性。测定抑制 VEGFR-2 磷酸化的浓度，计算 IC50 值。</p>
<p><b>细胞实验：</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> HUVECs  <b>Concentrations:</b> 1 nM-100 nM  <b>Incubation Time:</b> 1 小时  <b>Method:</b>          为了测评 Ki8751 抑制 VEGF 刺激的 HUVEC 增殖效果, HUVECs 按每孔 4000 个细胞接种在 I 型胶原预包被的 96 孔板上, 每孔为 200 <math>\mu</math>L。24 小时后, 用 Ki8751 处理细胞 1 小时, 然后用 20 ng/mL rhVEGF 刺激处理。然后在 37°C 下温育 72 小时, 然后每孔用 1 <math>\mu</math>Ci<sup>[3H]</sup> 胸苷进行脉冲处理, 然后再温育 14 小时。进行细胞实验使用液体闪烁计数器测定氚的渗透率。</p>

**【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。