

Vatalanib (PTK787) 2HCl ; 瓦他拉尼(PTK787) 2HCl

产品编号 : MB3992

质量标准 : >98%,VEGFR2/KDR 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C20H15ClN4.2HCl	结 构 式	
分子量	419.73		
CAS No.	212141-51-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 85 mg/mL (202.51 mM) Water : 10 mg/mL (23.82 mM) Ethanol : 6 mg/mL (14.29 mM)		
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 : 瓦他拉尼二盐酸盐 Vatalanib (PTK787; ZK-222584; CGP-79787) 是 VEGFR2/KDR 的抑制剂。

别名 : PTK787 dihydrochloride; CGP-797870 dihydrochloride; ZK-222584 dihydrochloride ; 瓦他拉尼二盐酸盐 ; Vatalanib (PTK787; ZK-222584; CGP-79787)

物理性状及指标 :

外观 :类白色至粉色固体

溶解性 :DMSO : 85 mg/mL (202.51 mM) ; Water : 10 mg/mL (23.82 mM) ; Ethanol : 6 mg/mL (14.29 mM)

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Vatalanib (PTK787) 2HCl 是一种 VEGFR2/KDR 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 37 nM, 对 VEGFR1/Flt-1 作用稍弱, 是 VEGFR3/Flt-4 抑制作用的 18 倍。				
靶点	VEGFR2/KDR (Cell-free assay)	VEGFR1/FLT1 (Cell-free assay)	VEGFR2/Flk1 (Cell-free assay)	PDGFRβ (Cell-free assay)	VEGFR3/FLT4 (Cell-free assay)
IC50	37 nM	77 nM	270 nM	580 nM	660 nM
体外研究	Vatalanib 有效抑制 VEGFR 酪氨酸激酶, 作用于 VEGF 受体/KDR, VEGF 受体/Flt-1, VEGF 受体/Flk, c-Kit 和 PDGFR-β 时, IC50 分别为 0.037 μM, 0.077 μM, 0.27 μM, 0.73 μM 和 0.58 μM。Vatalanib 抑制 VEGF 诱导的磷酸化, 作用于 HUVECs 和 CHO 细胞时, IC50 分别为 17 nM 和 34 nM。而且, Vatalanib 作用于 HUVECs, 具有通过抑制 VEGF 诱导的胸苷摄入而抗增殖效果, IC50 为 7.1 nM, 且相同剂量范围时抑制 VEGF 诱导的内皮细胞存活和迁移, 这种作用存在剂量依赖性, 且没有毒性, 或者作用于不表达 VEGF 受体的细胞没有抗增殖效果。最新研究显示 Vatalanib 明显抑制肝癌细胞生长, 且通过提高 Bax 蛋白水平和降低 Bcl-xL 和 Bcl-2 蛋白水平而增强 IFN/5-FU				

	诱导的凋亡。
体内研究	在体内, Vatalanib 按 25-100 mg/kg 剂量口服给药生长因子移植模型和肿瘤细胞驱动血管生成模型, 每天一次, 抑制对 VEGF 和 PDGF 血管生成反应。Vatalanib 按相同剂量处理裸鼠, 也抑制一些人类癌细胞生长和移位, 且对循环血细胞和骨髓白细胞没有影响。
特征	Vatalanib 是有效的 VEGFR 酪氨酸激酶和血管生成抑制剂。

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)

MB4527	BFH772
MB3946	BMS-794833
MB3995	Telatinib

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。Vatalanib (PTK787) 2HCl 是一种 VEGFR2/KDR 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	2.3825 mL	11.9124 mL	23.8248 mL
5 mM	0.4765 mL	2.3825 mL	4.7650 mL
10 mM	0.2382 mL	1.1912 mL	2.3825 mL
50 mM	0.0476 mL	0.2382 mL	0.4765 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>VEGF 受体酪氨酸激酶实验:</p> <p>在 96 孔板上进行体外激酶实验, 使用在杆状病毒体内表达的重组 GST 融合的激酶, 通过谷胱甘肽-琼脂糖凝胶纯化。使用 γ-^{33}PATP 作为磷酸供体, 聚(Glu:Tyr 4:1)肽段作为受体。重组 GST 融合蛋白在含 1-3 mM MnCl_2, 3-10 mM MgCl_2, 0.25 mg/mL 聚乙二醇 20000, 和 1 mM DTT 的 20 mM Tris-HCl(pH 7.5) 中稀释。每组 GST 融合激酶在含[20 mM Tris-HCl buffer (pH 7.5), 1-3 mM MnCl_2, 3-10 mM MgCl_2, 3-8 $\mu\text{g/mL}$ 聚(Glu:Tyr 4:1), 0.25 mg/mL 聚乙二醇 20000, 8 μM ATP, 10 μM 钒酸钠, 1 mM DTT, 和 0.2 μCi $[\gamma$-^{33}P]ATP 的优化 buffer 中, 总体积为 30 μL, 在有或无 实验底物存在时, 在室温下温育 10 分钟。加入 10 μL 250 mM EDTA 终止反应。使用 96 孔过滤系统, 转移一半体积 (20 μL) 到 Immobilon-聚偏二氟乙烯膜上。在 0.5% H_3PO_4 中大规模冲洗膜, 然后浸泡到甲醇中。烘干后, 加入 Microscint “鸡尾酒疗法” 试剂, 使用闪烁计数器计数。通过对抑制百分数的线性回归分析, 测定 PTK787/ZK 222584 或 SU5416 作用的 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HUVECs</p> <p>Concentrations: 0 到 10 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 测定 PTK787/ZK 222584 抑制 VEGF 的功能性反应, 根据 BrdUrd 摄入情况, 进行内皮细胞增殖实验。分汇合培养的 HUVECs 接种在用 1.5% 包被的 96 孔板上, 然后在 37°C 下生长培养基中温育。24 小时后, 用含 1.5% FCS 和恒定浓度 VEGF(50 ng/mL), bFGF(0.5 ng/mL), 或 FCS(5%) 的基础培养基, 在有或无 PTK787/ZK 222584 存在时, 更换生长培养基。作为对照, 有些孔里不加生长因子。温育 24 小时后, 加入 BrdUrd 标签溶液, 细胞再温育 24 小时, 固定处理, 阻</p>

	断处理, 然后加入过氧化物酶标记的 anti-BrdUrd 抗体。使用 3,3',5',5'-四甲基联苯胺底物测定结合的抗体, 通过分光光度计在 450 nm 处测量着色的反应产物。
动物实验	<p>Animal Models: 皮下注射 A431 上皮癌, Ls174T 结肠癌, HT-29 结肠癌, PC-3 前列腺癌, DU145 前列腺癌, 和 CWR-22 前列腺癌细胞的裸鼠</p> <p>Formulation: Vatalanib 溶于含 5% DMSO 和 1% Tween-80 的蒸馏水</p> <p>Dosages: 25 mg/kg 到 100 mg/kg</p> <p>Administration: 口服处理</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做好预处理, 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。