

PND-1186 (VS-4718) ; SR-2156

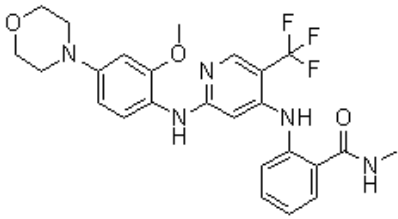
产品编号 : MB4110

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C25H26F3N5O3	结 构 式	
分子量	501.5		
CAS No.	1061353-68-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 24 mg/mL (47.85 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 : PND-1186 是有效可逆的 FAK 抑制剂。

别名 : SR-2516; VS-4718 ; Benzamide, 2-[[2-[[2-methoxy-4-(4-morpholinyl)phenyl]amino]-5-(trifluoromethyl)-4-pyridinyl]amino]-N-methyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至灰色固体

溶解性 :DMSO : 24 mg/mL (47.85 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

产品描述	PND-1186 (VS-4718)是一种可逆的选择性 FAK 抑制剂, IC50 为 1.5 nM。Phase 1。
靶点	FAK (Cell-free assay) 1.5 nM
体外研究	在体外, PND-1186 抑制 4T1 乳腺癌能动性, 在悬浮条件下促进 4T1 凋亡, 并减少 4T1 软琼脂集落数量和大小。在 HEY 和 OVCAR8 细胞中, VS-4718 促进 G0-G1 细胞周期阻滞, 进而使细胞死亡。

体内研究	负荷 4T1 肿瘤的小鼠体内, PND-1186(100 mg/kg s.c.) 通过诱导细胞凋亡, 抑制 4T1 皮下肿瘤生长。在负荷 ID8 肿瘤的小鼠体内, PND-1186 (0.5 mg/mL ,p.o.)也会导致卵巢癌肿瘤的生长抑制。
-------------	---

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)

MB2682	PF-562271
MB3968	PF-573228
MB3965	TAE226 (NVP-TAE226)

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。PND-1186 是有效可逆的 **FAK** 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	1.9940 mL	9.9701 mL	19.9402 mL
5 mM	0.3988 mL	1.9940 mL	3.9880 mL
10 mM	0.1994 mL	0.9970 mL	1.9940 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>体外激酶活性试验: 测量 GST-FAK 在体外的激酶活性, 与 His 标记的 FAK 411-686 相比, 使用 K-LISA 筛选试剂盒, 聚(Glu:Tyr) (4:1)聚合物作为底物固定在微量滴定板上。IC50 值用不同浓度的测试化合物在包含 50 μM ATP 和 10 mM MnCl₂, 50 mM HEPES (pH 7.5), 25 mM NaCl, 0.01% BSA, 以及 0.1 mM 原钒酸钠的缓冲液中于室温下测定 5 分钟。一系列稀释的化合物重复测定 3 次。底物磷酸化使用辣根过氧化物酶偶联的抗 pTyr 抗体与光度显色定量。IC50 值使用 Hill-Slope 模型测定。激酶选择性使用激酶分析器进行测定。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 小鼠 ID8 卵巢癌细胞 Concentrations: ~1 μM Incubation Time: 6 天 Method: 对于软琼脂测定法, 48 孔板涂覆 1:4 混合的 2%琼脂(EM Science)和 0.2 mL 生长培养基(底层)。在 0.3%软琼脂的 0.2 mL 生长培养基(上层)混合物中, 每孔接种 5×10⁴ 细胞(重复三份)。琼脂凝固后, 加入包含 DMSO 或 PND-1186 (终浓度 0.6 mL)的 0.2 mL 生长培养基。分解实验中, PND-1186 在 4 天后加入。10 天后, 菌落被相衬成像, 通过计数 9</p>

	个区域(每孔 3 个区域)进行计算，总面积使用 Image J 测定。对于所有分析，实验点以一式三份进行，并且至少重复 2 次。
动物实验	Animal Models: 负荷 ID8 肿瘤或 4T1 肿瘤的小鼠 Formulation: 聚乙二醇 400 (PEG400) 与 PBS (1:1) , s.c. ; 5% 蔗糖, p.o. Dosages: 100 mg/kg 每 12 小时, s.c. ; 0.5 mg/mL, p.o. Administration: s.c. 或 p.o.

【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(M ²)	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。