



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **ZM 306416**
CAS 号: **690206-97-4**
产品货号: **S75368**

生物活性:				
Description	ZM-306416 (CB 676475) 是 VEGFR 的有效抑制剂, 对 KDR 和 Flt 的 IC ₅₀ 值分别为 0.1 和 2 μM。ZM-306416 也是 EGFR 的抑制剂, IC ₅₀ 值小于 10 nM.			
IC ₅₀ & Target[1]	KDR 100 nM (IC ₅₀)	Flt-1 2 μM (IC ₅₀)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A498	IC ₅₀	14.1 μM	Inhibition of VEGFR1 tyrosine kinase activity in VEGF-stimulated human A498 cells after 60 mins by ELISA
	A498	IC ₅₀	14.1 μM	Inhibition of VEGFR1 phosphorylation in human A498 cells after 10 mins by FLISA
	A498	IC ₅₀	14.1 μM	Inhibition of VEGF-induced VEGFR1 phosphorylation in human A498 cells overexpressing Flt-1 pretreated for 60 mins prior to VEGF addition measured after 10 mins by phosphotyrosine ELISA cyto blot analysis
	A498	IC ₅₀	14.1 μM	Inhibition of VEGFR1 in human A498 cells by phosphotyrosine cell-based ELISA
	A498	IC ₅₀	17.7 μM	Inhibition of VEGF-induced VEGFR1 autophosphorylation in human A498 cells incubated for 60 mins prior to VEGF-induction measured after 10 mins by phosphotyrosine ELISA
	A498	IC ₅₀	17.7 μM	ELISA
In Vitro	ZM-306416 对 EGFR 依赖的 NSCLC 细胞系 H3255 和 HCC4011 具有选择性的抗增殖作用 (IC ₅₀ 分别为 0.09 μM 和 0.072 μM), 同时不影响野生型 EGFR 细胞系 A549 和 H2030 (IC ₅₀ >10 μM)。ZM-306416 还被发现可抑制 ABL 激酶的体外活性, 对 ABL 激酶的 IC ₅₀ 值较低, 为 1.3 μM[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (149.81 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H ₂ O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.9963 mL	14.9813 mL
		5 mM	0.5993 mL	2.9963 mL
		10 mM	0.2996 mL	1.4981 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。			
	动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。			



	以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.49 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Han SY, Park SS, Lee WG, Synthesis of a novel biotin-tagged photoaffinity probe for VEGF receptor tyrosine kinases. Bioorg Med Chem Lett. 2006 Jan 1;16(1):129-33. [2]. Antczak C, Mahida JP, Bhinder B, A high-content biosensor-based screen identifies cell-permeable activators and inhibitors of EGFR function: implications in drug discovery. J Biomol Screen. 2012 Aug;17(7):885-99.

完整储备液配制表：

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℃, 2 years; -20℃, 1 year。 -80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.9963 mL	14.9813 mL	29.9625 mL	74.9064 mL
	5 mM	0.5993 mL	2.9963 mL	5.9925 mL	14.9813 mL
	10 mM	0.2996 mL	1.4981 mL	2.9963 mL	7.4906 mL
	15 mM	0.1998 mL	0.9988 mL	1.9975 mL	4.9938 mL
	20 mM	0.1498 mL	0.7491 mL	1.4981 mL	3.7453 mL
	25 mM	0.1199 mL	0.5993 mL	1.1985 mL	2.9963 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	30 mM	0.0999 mL	0.4994 mL	0.9988 mL	2.4969 mL
	40 mM	0.0749 mL	0.3745 mL	0.7491 mL	1.8727 mL
	50 mM	0.0599 mL	0.2996 mL	0.5993 mL	1.4981 mL
	60 mM	0.0499 mL	0.2497 mL	0.4994 mL	1.2484 mL
	80 mM	0.0375 mL	0.1873 mL	0.3745 mL	0.9363 mL
	100 mM	0.0300 mL	0.1498 mL	0.2996 mL	0.7491 mL



源叶