



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: **SU 1498**
CAS 号: **168835-82-3**
产品货号: **S88053**

生物活性:

Description	SU1498 (AG 1498) 是选择性的 VEGFR2 抑制剂; 抑制 Flk-1 的 IC50 值为 700 nM。			
IC50 & Target[1]	Flk-1 700 nM (IC ₅₀)			
In Vitro	SU1498 刺激人脐静脉内皮细胞和人主动脉内皮细胞中磷酸化 ERK 的积累, 其方式依赖于 MAPK 通路上游成分 B-Raf 和 MEK 激酶的功能。磷酸化 ERK 的积累增强仅在受到鞘氨醇 1-磷酸或蛋白质生长因子刺激的细胞中观察到; SU1498 本身无效[2]。SU1498 阻断 MS1 VEGF 细胞中 VEGFR2 的信号转导。在 SU1498 存在下, Ets-1 水平降低, 这表明 VEGF-VEGFR-2 相互作用导致 Ets-1 表达的基线水平, 而使用 SU1498 中断这种自分泌相互作用会导致 Ets-1 表达降低[3]。SU1498 处理显著影响 U87 细胞增殖和凋亡。SU1498 诱导脂质显著增加, 甘油磷酸胆碱减少。因此, 在 SU1498 处理的 U87 细胞的细胞质中可见脂滴积聚[4]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (256.07 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.5607 mL	12.8034 mL
		5 mM	0.5121 mL	2.5607 mL
		10 mM	0.2561 mL	1.2803 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 (6.40 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 ddH ₂ O 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (6.40 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明,
参考文献	[1]. Strawn LM, et al. Flk-1 as a target for tumor growth inhibition. Cancer Res. 1996 Aug 1;56(15):3540-5. [2]. Boguslawski G, et al. SU1498, an inhibitor of vascular endothelial growth factor receptor 2, causes accumulation of phosphorylated ERK kinases and inhibits their activity in vivo and in vitro. J Biol Chem. 2004 Feb 13;279(7):5716-24. [3]. Arbiser JL, et al. Overexpression of VEGF 121 in immortalized endothelial cells causes conversion to slowly growing angiosarcoma and high level expression of the VEGF receptors VEGFR-1 and VEGFR-2 in vivo. Am J Pathol. 2000 Apr;156(4):1469-76. [4]. Mesti T, et al. Metabolic impact of anti-angiogenic agents on U87 glioma cells. PLoS One. 2014 Jun 12;9(6):e99198.

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° 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5607 mL	12.8034 mL	25.6069 mL	64.0172 mL
	5 mM	0.5121 mL	2.5607 mL	5.1214 mL	12.8034 mL
	10 mM	0.2561 mL	1.2803 mL	2.5607 mL	6.4017 mL
	15 mM	0.1707 mL	0.8536 mL	1.7071 mL	4.2678 mL
	20 mM	0.1280 mL	0.6402 mL	1.2803 mL	3.2009 mL
	25 mM	0.1024 mL	0.5121 mL	1.0243 mL	2.5607 mL
	30 mM	0.0854 mL	0.4268 mL	0.8536 mL	2.1339 mL
	40 mM	0.0640 mL	0.3201 mL	0.6402 mL	1.6004 mL
	50 mM	0.0512 mL	0.2561 mL	0.5121 mL	1.2803 mL
	60 mM	0.0427 mL	0.2134 mL	0.4268 mL	1.0670 mL
	80 mM	0.0320 mL	0.1600 mL	0.3201 mL	0.8002 mL
	100 mM	0.0256 mL	0.1280 mL	0.2561 mL	0.6402 mL