



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **SLV-2436**  
CAS 号: **2095704-43-9**  
产品货号: **S88568**

**生物活性:**

|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         |                                             |           |            |            |
|--------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|---------------------------------------------|-----------|------------|------------|
| Description        | SLV-2436 是一种高效且 ATP 竞争性的 MNK1 和 MNK2 抑制剂, IC50 分别为 10.8 nM 和 5.4 nM。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |                                             |           |            |            |
| IC50 & Target[1]   | MNK2                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | MNK1                                        |           |            |            |
|                    | 5.4 nM (IC50)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           | 10.8 nM (IC50)                              |           |            |            |
| In Vitro           | 为了确认 SLV-2436 (SEL201) 的激酶组选择性, 在 1 μM 浓度下进行广谱 KINOMEScan 竞争性结合试验, 该试验包括 450 种不同的激酶。观察到的 SLV-2436 结合谱显著集中在由 MNK1 和 MNK2 组成的 CAMK 激酶家族中。经 SLV-2436 处理的 KIT 突变型黑色素瘤细胞具有较低的致瘤性和较低的转移能力[1]。                                                                                                                                                                                                                                                 |                                             |           |            |            |
| In Vivo            | 为了研究 SLV-2436 (SEL201) 的药效学特性, 每 12 小时 (每日两次) 连续 5 次口服剂量为 10、25 和 50 mg/kg 给小鼠。在 10 mg/kg 每日两次剂量下, 第五次给药后 4 小时, 测得 SLV-2436 的低血浆浓度为 125 ng/mL。然而, 每天两次以 25 和 50 mg/kg 的剂量给药, 相当于 50 和 100 mg/kg/d 的 SLV-2436, 产生显著增加的剂量依赖性血浆暴露, 平均水平达到 1, 299 ng/mL 和 2, 075 ng/ mL, 分别。在 24 小时时间点, SLV-2436 仍可在血浆中检测到, 在 10、25 和 50 mg/kg 每日两次处理组中剂量依赖性浓度分别为 9、73 和 124 ng/mL。小鼠口服 (po) 50 mg/kg 剂量的 SLV-2436, 每天两次, 即 100 mg/kg/d, 持续 37 天, 耐受性良好[1]。 |                                             |           |            |            |
| Solvent&Solubility | 细胞实验:<br>DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (285.06 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)<br><br>* "≥" means soluble, but saturation unknown                                                                                                                                                                                                                                                                                                   |                                             |           |            |            |
|                    | Preparing Stock Solutions                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | <div>Solvent / Mass<br/>Concentration</div> | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | 1 mM                                        | 2.8506 mL | 14.2531 mL | 28.5063 mL |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | 5 mM                                        | 0.5701 mL | 2.8506 mL  | 5.7013 mL  |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                         | 10 mM                                       | 0.2851 mL | 1.4253 mL  | 2.8506 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。<br><br>储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。                                                                                                                                                                                                                                                                          |                                             |           |            |            |
| 参考文献               | [1]. Zhan Y, et al. MNK1/2 inhibition limits oncogenicity and metastasis of KIT-mutant melanoma. J Clin Invest. 2017 Nov 1;127(11):4179-4192.                                                                                                                                                                                                                                                                                           |                                             |           |            |            |

**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, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

| 可选溶剂 | 质量<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
|      |                  |           |            |            |            |
| DMSO | 1 mM             | 2.8506 mL | 14.2531 mL | 28.5063 mL | 71.2657 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|  |               |           |           |           |            |
|--|---------------|-----------|-----------|-----------|------------|
|  | <b>5 mM</b>   | 0.5701 mL | 2.8506 mL | 5.7013 mL | 14.2531 mL |
|  | <b>10 mM</b>  | 0.2851 mL | 1.4253 mL | 2.8506 mL | 7.1266 mL  |
|  | <b>15 mM</b>  | 0.1900 mL | 0.9502 mL | 1.9004 mL | 4.7510 mL  |
|  | <b>20 mM</b>  | 0.1425 mL | 0.7127 mL | 1.4253 mL | 3.5633 mL  |
|  | <b>25 mM</b>  | 0.1140 mL | 0.5701 mL | 1.1403 mL | 2.8506 mL  |
|  | <b>30 mM</b>  | 0.0950 mL | 0.4751 mL | 0.9502 mL | 2.3755 mL  |
|  | <b>40 mM</b>  | 0.0713 mL | 0.3563 mL | 0.7127 mL | 1.7816 mL  |
|  | <b>50 mM</b>  | 0.0570 mL | 0.2851 mL | 0.5701 mL | 1.4253 mL  |
|  | <b>60 mM</b>  | 0.0475 mL | 0.2376 mL | 0.4751 mL | 1.1878 mL  |
|  | <b>80 mM</b>  | 0.0356 mL | 0.1782 mL | 0.3563 mL | 0.8908 mL  |
|  | <b>100 mM</b> | 0.0285 mL | 0.1425 mL | 0.2851 mL | 0.7127 mL  |

源叶