



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: **JK-P3**
CAS 号: **942655-44-9**
产品货号: **S87796**

生物活性:

Description	JK-P3 是一种有效且具有广谱性的 VEGFR2 抑制剂, 对 VEGFR2、FGFR1 和 FGFR3 的 IC50 分别为 7.83 μM、27 μM 和 5.18 μM。JK-P3 可以抑制 VEGF-A 刺激的 VEGFR2 激活和细胞内信号转导, 也可以抑制内皮单层细胞迁移和血管生成, 以及成纤维细胞生长因子受体激酶在体外的活性。JK-P3 具有抗血管生成的活性。				
IC50 & Target[1]	VEGFR2 7.83 μM (IC50)	FGFR1 27 μM (IC50)	FGFR3 5.18 μM (IC50)		
In Vitro	JK-P3 (0.01-10 μM; 1 hour) inhibits VEGF-A-mediated VEGFR2 phosphorylation and downstream signalling[1].				
	JK-P3 (0.01-10 μM; 16 hours) dose not inhibit HUVEC cell proliferation at 0.01~1 μM, and shows slight inhibitory activity at 10 μM[1].				
	JK-P3 (1 and 10 μM; 1 hour) does not significantly inhibit VEGF-A-stimulated endothelial tube formation at 1 μM, but almost completely inhibits the ability of endothelial cells to form into elongated hollow tubes in the presence of VEGF-A at 10 μM[1].				
	Western Blot Analysis				
	Cell Line:	Primary endothelial cells (treated for 7.5 min with 25 ng/mL VEGF-A) ^[1]			
	Concentration:	0.01, 0.1, 1 and 10 μM			
	Incubation Time:	1 hour			
	Result:	Almost completely inhibited VEGFR2 Y1175 phosphorylation, also inhibited VEGF-A-stimulated PLCγ1, Akt and ERK1/2 phosphorylation.			
	Cell Proliferation Assay				
	Cell Line:	HUVEC ^[1]			
Concentration:	0.01, 0.1, 1 and 10 μM				
Incubation Time:	16 hours				
Result:	Failed to inhibit endothelial cell proliferation at 0.01~1 μM but elicited a small but significant increase in cell proliferation at certain lower concentrations.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (154.63 mM; 超声助溶 (<60°C); 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	10 mg
		1 mM	3.0926 mL	15.4631 mL	30.9262 mL
		5 mM	0.6185 mL	3.0926 mL	6.1852 mL
10 mM		0.3093 mL	1.5463 mL	3.0926 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, 6 months; -20°C, 1 month (protect from light)。-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。 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 (7.73 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 ddH₂ 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 (7.73 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 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.73 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]. Kankanala J, et al. A combinatorial in silico and cellular approach to identify a new class of compounds that target VEGFR2 receptor tyrosine kinase activity and angiogenesis. Br J Pharmacol. 2012;166(2):737-748.

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 (protect from light)。-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 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.0926 mL	15.4631 mL	30.9262 mL	77.3156 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

	5 mM	0.6185 mL	3.0926 mL	6.1852 mL	15.4631 mL
	10 mM	0.3093 mL	1.5463 mL	3.0926 mL	7.7316 mL
	15 mM	0.2062 mL	1.0309 mL	2.0617 mL	5.1544 mL
	20 mM	0.1546 mL	0.7732 mL	1.5463 mL	3.8658 mL
	25 mM	0.1237 mL	0.6185 mL	1.2370 mL	3.0926 mL
	30 mM	0.1031 mL	0.5154 mL	1.0309 mL	2.5772 mL
	40 mM	0.0773 mL	0.3866 mL	0.7732 mL	1.9329 mL
	50 mM	0.0619 mL	0.3093 mL	0.6185 mL	1.5463 mL
	60 mM	0.0515 mL	0.2577 mL	0.5154 mL	1.2886 mL
	80 mM	0.0387 mL	0.1933 mL	0.3866 mL	0.9664 mL
	100 mM	0.0309 mL	0.1546 mL	0.3093 mL	0.7732 mL

