



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: **KG5**
CAS 号: **877874-85-6**
产品货号: **S89531**

生物活性:

Description	KG5 是一种具有口服活性的双重 PDGFR β 和 B-Raf 变构抑制剂。KG5 还抑制 Flt3, KIT 和 c-Raf, 并具有抗癌, 抗血管生成活性。					
IC50 & Target[1]	B-Raf	PDGFRβ	FLT3	KIT	PDGFRα	C-Raf
		520 nM (Kd)	52 nM (Kd)	170 nM (Kd)	300 nM (Kd)	
In Vitro	KG5 (化合物 6) 抑制血管平滑肌细胞 (VSMC) 和内皮细胞的活力, EC50 值分别为 0.59 μM 和 0.54 μM[1]。					
	Compound 6 选择性地阻断 S338 磷酸化, 但不影响 S259[1]。					
In Vivo	KG5 (化合物 6) 仅抑制 PDGFR α 和 β, Kd 为分别为 300 和 520 nM, Flt3 和 KIT 分别为 52 和 170 nM[1]。					
	KG5 (化合物 6; 5 μM) 抑制内皮细胞中 MEK 和 ERK 的磷酸化用 bFGF 或 VEGF[1] 刺激。					
In Vivo	KG5 (化合物 6; 100 mg/kg; 口服给药; 每天; 持续 26 天) 处理可防止原位肾细胞癌模型中的肿瘤生长[1]。					
	KG5 (化合物 6; 50 mg/kg; 腹腔注射; 每天两次) 处理完全阻断小鼠中相对于载体对照的血管生成 (注射含有 bFGF 的 Matrigel)。所用 KG5 剂量和制剂的药代动力学分析表明 Cmax 为 3.6 μg/mL, T1/2 为 11.5 h, 浓度时间曲线下面积 (AUC0-12h) 为 14.7 μg h/mL[1]。					
	KG5 (化合物 6; 1 μM) 破坏血管生成过程中的后期步骤斑马鱼胚胎发生[1]。					
	Animal Model:		Male Nu/Nu mice injected with SN12C-RFP cells[1]			
	Dosage:		100 mg/kg			
	Administration:		Oral administration; daily; for 26 days			
Solvent&Solubility	Result:		Prevented tumor growth in an orthotopic renal cell carcinoma model.			
	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (217.65 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	10 mg	
		1 mM	2.1765 mL	10.8826 mL	21.7652 mL	
		5 mM	0.4353 mL	2.1765 mL	4.3530 mL	
10 mM		0.2177 mL	1.0883 mL	2.1765 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						



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

	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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.44 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]. Eric A Murphy, et al. Disruption of angiogenesis and tumor growth with an orally active drug that stabilizes the inactive state of PDGFRbeta/B-RAF. Proc Natl Acad Sci U S A. 2010 Mar 2;107(9):4299-304.

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	2.1765 mL	10.8826 mL	21.7652 mL	54.4129 mL
	5 mM	0.4353 mL	2.1765 mL	4.3530 mL	10.8826 mL
	10 mM	0.2177 mL	1.0883 mL	2.1765 mL	5.4413 mL
	15 mM	0.1451 mL	0.7255 mL	1.4510 mL	3.6275 mL
	20 mM	0.1088 mL	0.5441 mL	1.0883 mL	2.7206 mL
	25 mM	0.0871 mL	0.4353 mL	0.8706 mL	2.1765 mL
	30 mM	0.0726 mL	0.3628 mL	0.7255 mL	1.8138 mL
	40 mM	0.0544 mL	0.2721 mL	0.5441 mL	1.3603 mL
	50 mM	0.0435 mL	0.2177 mL	0.4353 mL	1.0883 mL
	60 mM	0.0363 mL	0.1814 mL	0.3628 mL	0.9069 mL
	80 mM	0.0272 mL	0.1360 mL	0.2721 mL	0.6802 mL
	100 mM	0.0218 mL	0.1088 mL	0.2177 mL	0.5441 mL