

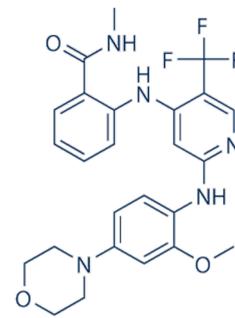
## PND-1186 (FAK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1162-10mM	PND-1186 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1162-5mg	PND-1186 (FAK抑制剂)	5mg
SC1162-25mg	PND-1186 (FAK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[[2-(2-methoxy-4-morpholin-4-ylanilino)-5-(trifluoromethyl)pyridin-4-yl]amino]-N-methylbenzamide
简称	PND-1186
别名	VS-4718, PND 1186, PND1186, VS4718, VS 4718
中文名	N/A
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub>
分子量	501.5
CAS号	1061353-68-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 24mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.00ml DMSO, 或每5.02mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1162-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PND-1186 (VS-4718)是一种可逆的选择性FAK抑制剂, IC <sub>50</sub> 为1.5nM。Phase 1。			
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling			
靶点	FAK	—	—	—
IC <sub>50</sub>	0.5nM	—	—	—
体外研究	在体外, PND-1186抑制4T1乳腺癌能动性, 在悬浮条件下促进4T1凋亡, 并减少4T1软琼脂集落数量和大小。在HEY和OVCAR8细胞中, VS-4718促进G0-G1细胞周期阻滞, 进而使细胞死亡。			
体内研究	负荷4T1肿瘤的小鼠体内, PND-1186(100mg/kg s.c.)通过诱导细胞凋亡, 抑制4T1皮下肿瘤生长。在负荷ID8肿瘤的小鼠体内, PND-1186(0.5mg/ml, p.o.)也会导致卵巢癌肿瘤的生长抑制。			
临床实验	N/A			
特征	N/A			

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	测量GST-FAK在体外的激酶活性, 与His标记的FAK 411-686相比, 使用K-LISA筛选试剂盒, 聚(Glu:Tyr)(4:1)聚合物作为底物固定在微量滴定板上。IC <sub>50</sub> 值用不同浓度的测试化合物在包含50μM ATP和10mM MnCl <sub>2</sub> , 50mM HEPES(pH 7.5), 25mM NaCl, 0.01% BSA, 以及0.1mM原钒酸钠的缓冲液中于室温下测定5分钟。一系列稀释的化合物重复测定3次。底物磷酸化使用辣根过氧化物酶偶联的抗pTyr抗体与光度显色定量。IC <sub>50</sub> 值使用Hill-Slope模型测定。激酶选择性使用激酶分析器进行测定。

细胞实验	
细胞系	小鼠ID8卵巢癌细胞
浓度	~1μM
处理时间	6天
方法	对于软琼脂测定法, 48孔板涂覆1: 4混合的2%琼脂(EM Science)和0.2ml生长培养基(底层)。在0.3%软琼脂的0.2ml生长培养基(上层)混合物中, 每孔接种5×10 <sup>4</sup> 细胞(重复三份)。琼脂凝固后, 加入包含DMSO或PND-1186(终浓度0.6ml)的0.2ml生长培养基。分解实验中, PND-1186在4天后加入。10天后, 菌落被相衬成像, 通过计数9个区域(每孔3个区域)进行计算, 总面积使用Image J测定。对于所有分析, 实验点以一式三份进行, 并且至少重复2次。

动物实验	
动物模型	负荷ID8肿瘤或4T1肿瘤的小鼠
配制	聚乙二醇 400 (PEG400)与PBS (1:1) , s.c.; 5%蔗糖, p.o.
剂量	100mg/kg每12小时, s.c.; 0.5mg/ml, p.o.
给药方式	s.c.或p.o.

➤ **参考文献:**

- 1.Tanjoni I, et al. Cancer Biol Ther. 2010, 9(10), 764-777.
- 2.Tancioni I, et al. Mol Cancer Ther. 2014, 13(8), 2050-2061.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1162-10mM	PND-1186 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1162-5mg	PND-1186 (FAK抑制剂)	5mg
SC1162-25mg	PND-1186 (FAK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

**使用说明:**

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01