

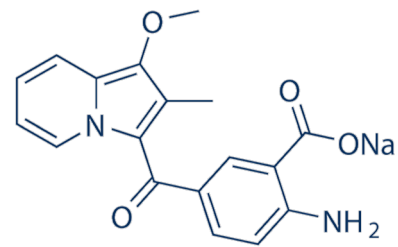
## SSR128129E (FGFR抑制剂)

| 产品编号        | 产品名称                 | 包装         |
|-------------|----------------------|------------|
| SC1103-10mM | SSR128129E (FGFR抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC1103-5mg  | SSR128129E (FGFR抑制剂) | 5mg        |
| SC1103-25mg | SSR128129E (FGFR抑制剂) | 25mg       |

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

|        |   |
|--------|---|
| 化学名    | sodium;2-amino-5-(1-methoxy-2-methylindolizine-3-carbonyl)benzoate  |
| 简称     | SSR128129E  |
| 别名     | SSR 128129E, SSR, SSR-128129E                                       |
| 中文名    | N/A   |
| 化学式    | C <sub>18</sub> H <sub>15</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub> .Na   |
| 分子量    | 346.31  |
| CAS号   | 848318-25-2   |
| 纯度     | 98%   |
| 溶剂/溶解度 | Water 1mg/ml; DMSO 69mg/ml; Ethanol <1mg/ml                         |
| 溶液配制   | 5mg加入1.44ml DMSO, 或每3.46mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1103-10mM用DMSO配制。 |



#### ➤ 生物信息:

|                  |  |   |   |   |   |
|------------------|--|---|---|---|---|
| 产品描述             | SSR128129E是口服效果较好的变构FGFR抑制剂, IC <sub>50</sub> 为1.9μM, 对别的关联RTKs无效果。  |   |   |   |   |
| 信号通路             | Angiogenesis; Protein Tyrosine Kinase  |   |   |   |   |
| 靶点               | FGFR1  | — | — | — | — |
| IC <sub>50</sub> | 1.9μM  | — | — | — | — |
| 体外研究             | 由于变构机制, SSR128129E在细胞实验中表现出更强的活性。SSR128129E剂量依赖性的抑制FGF2-诱导的EC增殖和迁移, IC <sub>50</sub> 分别为31nM和15.2nM。作为多靶点FGFR抑制剂, SSR128129E抑制了FGFR1-4介导的反应, 从而导致在多种细胞系中增殖和/或迁移被阻断, 比如mPanc02、HEK-hFGFR2WT、PAE-hFGFR1、hB9-myeloma和HUVEC。 |   |   |   |   |
| 体内研究             | 在患有关节炎的小鼠身上, SSR128129E(30mg/kg, p.o.)抑制了血管生成、炎症和骨吸收, 同时缓解了临床症状。在各种小鼠肿瘤模型中, SSR128129E(30mg/kg, p.o.)同时抑制了原发性肿瘤的增殖和转移。另外, SSR128129E抑制抗VEGFR2顽固型肿瘤模型和敏感株的增殖, 同时提高抗VEGFR2的抗肿瘤活性。SSR128129E也能够在静脉移植或者在缺失载脂蛋白E的小鼠模型中抑制动脉硬化。 |   |   |   |   |
| 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      | SPA蛋白质珠子悬浮在20mg/ml的PBS中, 被缓冲液(KCl, 400mg/L; MgSO <sub>4</sub> 200mg/L; NaCl 6.4g/L; NaHCO <sub>3</sub> 3.7g/L; NaH <sub>2</sub> PO <sub>4</sub> 0.141mg/ml; bis Tris Propane 11.292g/L; Glucose 4.5g/L; Gelatin 0.1%, pH 7.0)稀释成10mg/ml。同时将125I-FGF-2放射性配体FGFR-IIIcβ-Fc嵌合体放入缓冲液中。最后将缓冲液放到96孔板中并用0.1%的明胶包被。实验总体积为0.1ml。125I-FGF-2的结合性用蛋白质A(0.5mg/assay)包被的SPA珠子和可溶性受体FGFR-IIIcβ-Fc嵌合体(5ng/assay)测定, FGF-2(20ng/assay)被用于测定非特异性的结合性。 |

| 细胞实验 |                        |
|------|------------------------|
| 细胞系  | 内皮细胞系(ECs)和Panc02肿瘤细胞系 |
| 浓度   | 100nM左右                |
| 处理时间 | 72小时                   |

|    |   |
|----|---|
| 方法 | 成几何级数增殖的猪主动脉内皮细胞和肿瘤细胞系的细胞增殖实验是将细胞放在0.2%FBS的培养基中进行16小时的饥饿处理并放入96孔板中，每个孔板4000个细胞。在同时或者单独使用分裂素和SSR 72小时后，细胞增殖情况根据厂商指导用CellTiter 96AQueous单溶液细胞增殖检测试剂盒测定。加入10%FBS的培养基被用作阳性对照。 |
|----|---|

| 动物实验 |  |
|------|--|
| 动物模型 | 有胰腺肿瘤细胞株Panc02，小鼠乳腺癌细胞株4t1，小鼠结肠癌细胞株CT26，或人类乳腺癌MCF7/ADR细胞线关节炎和小鼠肿瘤模型。 |
| 配制   | 0.6%甲基纤维素  |
| 剂量   | 大约30mg/kg  |
| 给药方式 | 口服   |

➤ **参考文献:**

1. Bono F, et al. Cancer Cell. 2013, 23(4), 477-488.
2. Dol-Gleizes F, et al. PLoS One. 2013, 8(11), e80027.

**包装清单:**

| 产品编号        | 产品名称                 | 包装         |
|-------------|----------------------|------------|
| SC1103-10mM | SSR128129E (FGFR抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC1103-5mg  | SSR128129E (FGFR抑制剂) | 5mg        |
| SC1103-25mg | SSR128129E (FGFR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