

塞卡替尼 ; Saracatinib ; AZD0530

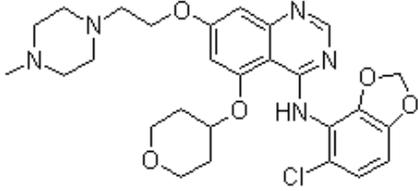
产品编号 : MB1214

质量标准 : ≥98.50% ; Src 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : 白色粉末

基本信息

分子式	C27H32ClN5O5	结构式	
分子量	542.03		
CAS No.	379231-04-6		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 35 mg/mL warmed (64.57 mM) Ethanol : 31 mg/mL (57.19 mM) Water Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

物理性状及指标 :

外观 :白色粉末

溶解性 :溶于 DMSO (35 mg/ml 加热)、乙醇(~ 31mg/ml) ; 几乎不溶于水

生物活性

产品描述	Saracatinib (AZD0530)是一种有效的 Src 抑制剂,无细胞试验中 IC50 为 2.7 nM ,对 c-Yes , Fyn , Lyn , Blk , Fgr 和 Lck 也具有活性 ; 但对 Abl 和 EGFR (L858R 和 L861Q)活性较低。				
特性	Saracatinib 是第一个作用于人类肿瘤组织 Src 通路的抑制剂。				
靶点	c-Src (Cell-free assay)	LCK (Cell-free assay)	c-YES (Cell-free assay)	EGFR (L861Q) (Cell-free assay)	Lyn (Cell-free assay)
	2.7 nM	<4 nM	4 nM	4 nM	5 nM
体外研究	Saracatinib 也有效抑制其他 Src 酪氨酸激酶家族成员 ,包括 c-Yes, Fyn, Lyn, Blk, Fgr, 和 Lck ,IC50 为 4 到 10 nM。Saracatinib 有效抑制 SrcY530F 突变的 NIH 3T3 细胞 ,IC50 为 80 nM。在 NBT-II 膀胱癌细胞中, Saracatinib 显著阻断 HT1080 细胞通过立体骨胶原基质的入侵, 且完全抑制 EGF 诱导的细胞分散。Saracatinib 作用于 DU145 和 PC3 细胞, 通过抑制 Y419 磷酸化而有效抑制 Src 激活。Saracatinib 抑制前列腺癌包括 PC3, DU145, CWR22Rv1 和 LNCaP 的生长, 而 Saracatinib 作用于 LAPC-4, PZ-HPV7 和 RWPE-1 细胞时却显示低活性。Saracatinib 使细胞周期停止在 G1/S 期, 但是不使 caspase 3 断裂。Saracatinib 也明显抑制 Boyden 小室的 DU145 和 PC3 移动。Saracatinib 有效且持久抑制 Akt, 且增强 A549 和 Calu-6 细胞对放射处理的敏感性。Saracatinib 在活性, 再吸收, 及组成上抑制蚀骨细胞。Saracatinib 也可逆阻断蚀骨细胞前体的移动				
体内研究	Saracatinib 作用于 Src3T3 异体移植瘤显示出强的肿瘤生长抑制率, 且 Saracatinib 造成 Calu-6, MDA-MB-231, AsPc-1 和 BT474C 移植瘤生长适当延迟。Saracatinib 处理常位 DU145 鼠, 按鼠体重, 每千克每天口服处理 25mg Saracatinib, 结果显示出强的抗癌活性				

用途及描述 : 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体 。

储液配置

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.8449 mL	9.2246 mL	18.4492 mL
5 mM		0.3690 mL	1.8449 mL	3.6898 mL
10 mM		0.1845 mL	0.9225 mL	1.8449 mL
50 mM		0.0369 mL	0.1845 mL	0.3690 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>激酶实验: 使用受体和非受体酪氨酸激酶的重组催化区,通过酶联免疫吸附法测定酪氨酸激酶活性的 IC50 值。加入的 Saracatinib 剂量从 0.001 到 10 mM 不等。针对丝氨酸/苏氨酸激酶的特异性实验是加 32P 的渗透捕捉实验。在加入 10 μL 20mM Mg.ATP 开始反应前,包含 0.5 μL Saracatinib 或 DMSO(作对照) 或 pH 3.0 buffer(作对照)的多支路 384 孔板加入 15 μL 酶和肽/蛋白底物温育 5 分钟。所有酶的最终浓度都接近米氏常数 (Km)。实验在室温下进行 30 分钟,然后加入 5 μL 正磷酸终止反应。混合后,孔中的内含物加到 P81 联合板上,使用正磷酸作为洗涤缓冲液,然后计算 IC50 值。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: PC3, DU145, CWR22Rv1, LNCaP, LAPC-4, PZ-HPV7, 和 RWPE-1 细胞 Concentrations: 62.5 nM-16 mM Incubation Time: 1, 3, 和 5 天 Method: PC3, DU145, CWR22Rv1, LNCaP, LAPC-4, PZ-HPV7 及 RWPE-1 细胞按 2×10^3 密度接种在 96 孔板上,温育过夜。加入浓度不等 (62.5 nM-16 mM) 的 Saracatinib。1,3,5 天后分离培养基,每孔加入 0.2 mL DMSO,按每分钟 200 轮持续震荡 96 孔板 15 分钟。MTT 实验测 IC50 值。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 移植 DU145 细胞的 CB17 鼠 Formulation: 溶于 0.5% 羟丙基甲基纤维素和 0.1% Tween-80 中 Dosages: 25 mg/kg Administration: 每天口服处理</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装,若用于细胞培养,请提前做预处理,除去热原细菌,否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息,我司不保证所提供信息的权威性,以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。