

## Masitinib ; 马赛替尼(AB1010)

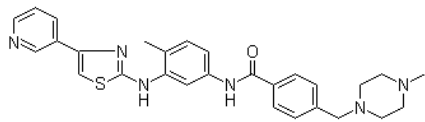
产品编号 : MB1579

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : 白色至黄色固体

### 基本信息

分子式	C28H30N6OS	结构式	
分子量	498.64		
CAS No.	790299-79-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (200.54 mM) Water Insoluble Ethanol : 4 mg/mL (8.02 mM)		
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。		

**简介 :** 马赛替尼 Masitinib 是一种有效的 Kit 和 PDGFR $\alpha$ / $\beta$  抑制剂, IC50 值为 200 nM 和 540 nM/800 nM, 对 ABL 和 c-Fms 也有微弱抑制作用。

**别名 :** AB1010;Masivet;AB-1010;AB 1010;

N-(4-methyl-3-(4-(pyridin-3-yl)thiazol-2-ylamino)phenyl)-4-((4-methylpiperazin-1-yl)methyl)benzamide;

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (200.54 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 4 mg/mL (8.02 mM)

含量 : .....>98%,BR

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	Masitinib (AB1010)是一种新型的 Kit 和 PDGFR $\alpha$ / $\beta$ 抑制剂, IC50 分别为 200 nM 和 540 nM/800 nM, 但对 ABL 和 c-Fms 抑制作用较弱。			
特性	Masitinib 比其他酪氨酸抑制剂安全性更好。			
靶点	Kit 200 nM	Lyn B 510 nM	PDGFR $\alpha$ 540 nM	PDGFR $\beta$ 800 nM
体外研究	Masitinib 浓度 $\leq$ 500 nM 时为 ATP 竞争性抑制剂。Masitinib 也有效抑制重组 PDGFR 和胞内激酶 Lyn, 及 FGFR 3。然而, Masitinib 对 ABL 和 c-Fms 抑制效果很弱。Masitinib 作用于脱颗粒, 细胞因子产生 和骨髓肥大细胞迁移时, 抑制效果比 imatinib 强很多。在表达人类野生型 KIT 的 Ba/F3 细胞中, Masitinib 抑制 SCF (干细胞因子)诱导的细胞增殖, IC50 为 150 nM, 而抑制 IL-3 刺激的增殖时, IC50 值约 $>10 \mu$ M。在表达 PDGFR- $\alpha$ 的 Ba/F3 细胞中, Masitinib 抑制 PDGF-BB 刺激的增殖和 PDGFR- $\alpha$ 酪氨酸磷酸化作用, IC50 为 300 nM。Masitinib 作用于肥大细胞瘤细胞系和 BMMC, 也抑制刺激的人类 KIT 酪氨酸磷酸化。Masitinib 作用于 Ba/F3 细胞, 抑制 KIT 获得			

Abl1  
1.20  $\mu$ M

	的功能突变, 包括 V559D 突变和 Δ27 鼠突变, IC50 分别为 3 和 5 nM。Masitinib 抑制肥大细胞瘤细胞系包括 HMC-1α155 和 FMA3 的细胞增殖, IC50 分别为 10 和 30 nM。Masitinib 作用于两种新型 ISS 细胞系, 抑制细胞生长和 PDGFR 磷酸化作用, 说明 Masitinib 抑制原代和转移 ISS 细胞系, 且在 ISS 的临床处理上有帮助。
体内研究	30 mg/kg Masitinib 作用于表达 Δ27 的 Ba/F3 移植瘤模型, 抑制肿瘤生长和提高培养基存活时间, 对心脏和基因都没有毒性。每天口服 12.5 mg/kg Masitinib 提高全部的 TTP (随时间增长的肿瘤)。Masitinib 和 gemcitabine 联用抑制抗 gemcitabine 的细胞系 Mia Paca2 和 Panc1 增殖时, 显示出协同作用。

#### 美仑相关产品推荐

MB3947	CP-673451
MB2752	Crenolanib (CP868596)

**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。Masitinib (AB1010) 是一种新型的 Kit 和 PDGFRα/β 抑制剂。可用于相关领域的科学研究。

#### 储液配置

体 积 浓度	质 量 1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0055 mL	10.0273 mL	20.0545 mL
5 mM	0.4011 mL	2.0055 mL	4.0109 mL
10 mM	0.2005 mL	1.0027 mL	2.0055 mL
50 mM	0.0401 mL	0.2005 mL	0.4011 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p><b>体外酶联免疫法和重组蛋白激酶:</b></p> <p>用 0.25mg/ml 聚(Glu,Tyr 4:1)过夜处理包被的 96 孔微型板, 用 250 μL 冲洗 buffer (10 mM 磷酸盐缓冲液 pH 为 7.4, 和 0.05% Tween-20) 冲洗 2 次, 然后在室温下烘干 2 小时。在室温下进行实验, 加入体积为 50μL 激酶 buffer (10 mM MgCl<sub>2</sub>, 1 mM MnCl<sub>2</sub>, 1 mM 原钒酸钠, 20 mM HEPES, pH 为 7.8), 且含 ATP 和适当重组酶, 确保线性反应速率。加入酶, 反应开始, 加入 50 μL 100 mM EDTA 终止反应。冲洗板 3 次, 和 1:3×10<sup>4</sup> 辣根过氧化物酶结合的磷酸酪氨酸单克隆抗体温育, 然后再冲洗 3 次, 然后和四甲基联苯胺温育。分光光度法在 450nm 处测定反应终产物。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 表达野生型或突变型人类 KIT, HMC1, HMC-1α155 的 Ba/F3 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 0.1 到 10<sup>4</sup> nM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 在 Ba/F3 细胞增殖实验中, 微型板上每孔接种 10<sup>4</sup> 个细胞, 孔中含 100 μL RPMI 1640 培养基和 10% 胎牛血清, 在 37°C 下培养。加入 X63-IL-3 细胞的 0.1% 条件培养基或 250 ng/mL 鼠的 SCF 作为补充。鼠 SCF 可激活 KIT, 从 SCF 产生的 CHO 细胞的条件培养基中纯化而得。加入 Masitinib, 细胞在 37°C 下生长 48 小时, 然后每孔加入 10 μL WST-1 试剂, 在 37°C 下温育 3 小时。使用多光谱扫描器在 450nm 处测定吸光值, 计数形成的甲腊染料数。没有细胞的空白孔作为对照。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 携带 Ba/F3 Δ27 移植瘤的雌性 MBRI Nu/Nu 鼠</p> <p><b>Formulation:</b> DMSO</p>

**Dosages:** 30 mg/kg (腹腔注射)或 0 (对照), 10, 30,或 45 mg/kg (口服处理).

**Administration:** 腹腔注射或口服处理

**【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。