

Imatinib ; 伊马替尼

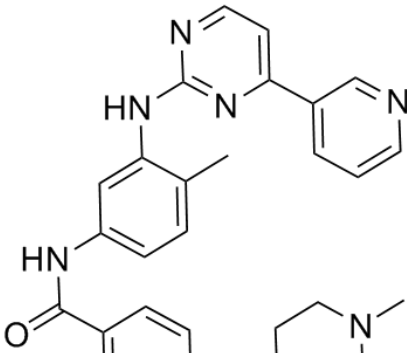
产品编号 : MB2031

质量标准 : >98.5%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 微黄色至白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C ₂₉ H ₃₁ N ₇ O	结 构 式	
分子量	493.60		
CAS No.	152459-95-5		
储存条件	常温, 防潮密闭避光		
溶解性 (25°C)	DMSO : 33 mg/mL (66.85 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol 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。		

简介:伊马替尼 Imatinib 是一种 c-Kit, Bcr-Abl 和 PDGFR 酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 SLF 依赖性的 c-Kit^{wt} 激活, IC₅₀ 为 100 nM。

别名: STI571 ; STI-571; imatinib;Benzamide ;

4-[(4-methyl-1-piperazinyl)methyl]-N-[4-methyl-3-[[4-(3-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]amino]phenyl]-

物理性状及指标 :

外观 :微黄色至白色结晶性粉末

熔点 :207~209°C

溶解性 :DMSO : 33 mg/mL (66.85 mM);Water Insoluble;Ethanol Insoluble

密度 :~1.3 g/cm³ (预测)

干燥失重 :≤1.0%

含量 :>98.5%

IC₅₀ :c-Abl: IC₅₀ = 1.1 nM (人); 酪氨酸蛋白激酶 ABL: IC₅₀ = 10.8 nM (小鼠);

.....PDGFR-α: IC₅₀ = 18 nM (人); MATE1: IC₅₀ = 40 nM (人); DDR1: IC₅₀ = 43 nM (人)

储存条件: 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Imatinib (STI571)是一种多靶点酪氨酸激酶抑制剂, 抑制 v-Abl、c-Kit 和 PDGFR 的 IC ₅₀ 分别为 0.6, 0.1 和 0.1 μM。		
特性	Imatinib 是多靶点酪氨酸激酶抑制剂。		
靶点	PDGFR (Cell-free assay)	c-Kit (M-07e cells)	v-Abl (Cell-free assay)

	100 nM	100 nM	600 nM
体外研究	体外抑制一组酪氨酸和丝/苏氨酸蛋白激酶实验，说明 Imatinib 有效抑制 v-Abl 酪氨酸激酶和 PDGFR，IC50 分别为 0.6 和 0.1 μ M。Imatinib 抑制野生型 c-kit 激酶活性的 SLF 依赖性激活，IC50 约为 0.1 μ M，与抑制 PDGFR 所需的浓度相似。Imatinib 抑制人类支气管类癌细胞 NCI-H727 和胰腺类癌细胞 BON-1 生长，IC50 分别为 32.4 和 32.8 μ M。最新研究显示 Imatinib 作用于慢性粒细胞白血病，通过下调 hERG1 K(+)通道，具有恢复其抗白血病效果的潜力，而 hERG1 K(+) 通道在白血病细胞中高表达，且易引发白血病。		
体内研究	Imatinib 作用于三种从新鲜人类小细胞肺癌衍生的移植瘤，具有不同的抗肿瘤效果，抑制 SCLC6, SCLC61 和 SCLC108 肿瘤生长分别达 80%, 40% 和 78%，而对 SCLC74 生长没有明显抑制效果。Imatinib 处理高脂肪饲养的 ApoE(-/-)小鼠，显著降低高脂肪诱导的脂质染色区，按 10,20 和 40 mg/kg 剂量饲喂，与未经高脂肪饮食处理的对照组相比，脂质染色区分别降低 30%, 27% 和 35%，且抑制颈动脉脂质堆积。		

美仑相关产品推荐

MB1122	Imatinib Mesylate
MB20324	N-去甲伊马替尼
MB1122-S	甲磺酸伊马替尼（标准品）
MB9622	伊马胺

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。伊马替尼在体内外均可在细胞水平上抑制 Bcr-Ab1 酪氨酸激酶，能选择性抑制 Bcr-Ab1 阳性细胞系细胞、费城染色体阳性(Ph+)的慢性髓性白血病(CML)和急性淋巴细胞白血病患者的新鲜细胞的增殖和诱导其凋亡。此外，伊马替尼还可抑制血小板衍生生长因子(PDGF)受体、干细胞因子(SCF)，c-Kit 受体的酪氨酸激酶，从而抑制由 PDGF 和干细胞因子介导的细胞行为。胃肠道间质肿瘤(GIST)细胞表达活性 kit 欠变，体外实验显示伊马替尼抑制 GIST 细胞的增殖并诱导其凋亡。

储液配置

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0259 mL	10.1297 mL	20.2593 mL
5 mM	0.4052 mL	2.0259 mL	4.0519 mL
10 mM	0.2026 mL	1.0130 mL	2.0259 mL
50 mM	0.0405 mL	0.2026 mL	0.4052 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	PDGF 受体激酶活性： 从 BALB/c 3T3 细胞抽提物中使用兔抗血清免疫沉淀 PDGF 受体，然后小鼠 PDGF 受体置于冰上 2 小时。使用蛋白 A-琼脂糖磁珠，用于收集抗原-抗体复合物。使用 TNET (50 mM Tris, pH 7.5, 140 mM NaCl, 5 mM EDTA, 1% Triton X-100)冲洗免疫沉淀反应两次，使用 TNE (50 mM Tris, pH 7.5, 140 mM EDTA)冲洗一次，再使用激酶 buffer (20 mM Tris, pH 7.5, 10 mM MgCl ₂)冲洗一次。在 40C 下使用 PDGF(50 ng/mL)刺激 10 分钟，在反应混合物中加入不同浓度 Imatinib。与 10 μ Ci [7-33P]-ATP 及 1 μ M ATP 在 40C 下温育 10 分钟，
--------------	---

	然后测定 PDGF 受体激酶活性。通过 SDS-PAGE 在 7.5% 凝胶上分离免疫复合物。
细胞实验：	Cell lines: BON-1 和 NCI-H727 细胞 Concentrations: 0 到 100 μ M Incubation Time: 48 小时 Method: BON-1 细胞和 NCI-H727 细胞按一式三份接种在平底 96 孔板上, 分别在补充 10%胎牛血清的 DMEM 或 RPMI 1640 完全培养基中粘附过夜, 更换培养基为无血清培养基(阴性对照) 或含连续稀释 Imatinib 的无血清培养基。48 小时后 (对照组细胞不汇合), 通过 MTT 实验测定代谢活性细胞数, 使用 Packard Spectra 酶标仪在 540 nm 处测定吸光值。按如下公式计算抑制生长率: 抑制率=(1 - a / b) \times 100%, a 和 b 分别为实验组和对照组的吸光值。
动物实验：	Animal Models: SCLC6, SCLC61, SCLC 74 和 SCLC108 小细胞注射进 Swiss 小鼠 (nu/nu, 雌性) Formulation: Imatinib 在水中稀释 Dosages: 70 或 100 mg/kg Administration: 腹腔注射

【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(M ²)	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。