

### SGX-523

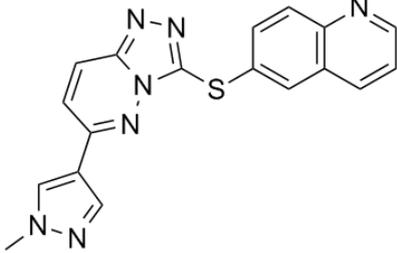
产品编号：MB3004

质量标准：>98%，Met 抑制剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：棕褐色粉末

#### 基本信息

分子式	C18H13N7S	结构式	
分子量	359.41		
CAS No.	1022150-57-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 3 mg/mL warmed (8.34 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：**SGX-523 是 Met 抑制剂，IC50 为 4 nM，对 BRAFV599E，c-Raf，Abl 和 p38α 无活性。

**别名：**6-(6-(1-Methyl-1H-pyrazol-4-yl)-[1,2,4]triazolo[4,3-b]pyridazin-3-ylthio)quinoline, SGX523

#### 物理性状及指标：

外观：.....棕褐色粉末

溶解性：.....DMSO : 3 mg/mL warmed (8.34 mM);Water : Insoluble;Ethanol : Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

#### 生物活性

<b>产品描述</b>	SGX-523 是选择性的 Met 抑制剂，IC50 为 4 nM，对 BRAFV599E，c-Raf，Abl 和 p38α 没有抑制活性。		
<b>靶点</b>	<table border="1"> <tr> <td>c-Met (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>4 nM</td> </tr> </table>	c-Met (Cell-free assay)	4 nM
c-Met (Cell-free assay)			
4 nM			
<b>体外研究</b>	SGX-523 属于 c-Met/肝细胞生长因子受体 (HGFR) 酪氨酸激酶抑制剂，使 MET 处于失活状态而不能接近其他蛋白激酶。SGX523 有效抑制纯化的 MET 催化区，而不是紧密相关的受体酪氨酸激酶 RON。SGX523 是 ATP 竞争性抑制剂，作用于低活性和非磷酸化的 MET 时亲和力更高 (MET-KD(0P), Ki = 2.7 nM)。SGX523 在纳摩尔浓度抑制 MET 调节的信号,细胞增殖和细胞迁移，但是对依赖其他蛋白激酶的信号，即使在微摩尔浓度也没有抑制效果，如 RON。SGX523 在体内抑制 MET，与人类恶性胶质瘤、肺癌、及胃癌衍生的移植瘤生长的剂量依赖性抑制相关，说明这些肿瘤依赖 MET 的催化活性。		
<b>体内研究</b>	SGX523 按≥10 mg/kg 剂量口服处理，每天两次，明显延迟预先设定的 GTL16 肿瘤生		

长。SGX523 按 30 mg/kg 剂量处理，每天两次，有效抑制 U87MG 肿瘤生长。SGX523 按 30 mg/kg 剂量每天处理两次，也延迟 H441 肿瘤生长，伴随着 MET 自磷酸化水平降低。在体内，SGX523 抑制 MET，存在剂量依赖性，和恶性胶质瘤，肺，胃癌相关，说明肿瘤与 MET 催化活性有关。

**美仑相关产品推荐**

MB5669	INCB28060
MB5240	JNJ38877605
MB8803	PHA-665752
MB3004	SGX-523
MB3143	SU11274
MB9673	Tivantinib (ARQ 197)

**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。SGX-523 是 Met 抑制剂，IC50 为 4 nM，对 BRAFV599E，c-Raf，Abl 和 p38α 无活性。可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7823 mL	13.9117 mL	27.8234 mL
5 mM	0.5565 mL	2.7823 mL	5.5647 mL
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验：</b>	<b>激酶实验：</b> 加入 100 mM HEPES (pH 为 7.5), 0.3 mg/ml 聚 Glu-Tyr 肽底物, 10 mM MgCl <sub>2</sub> , 1 mg/ml 牛血清蛋白, 5% DMSO, 20 nM MET-KD, 各种浓度的 ATP, 及 SGX523, 在 21°C 下测定初始速率。加入 20 μl Kinase-Glo 检测 buffer 终止反应。使用光度计测定荧光, 通过回归曲线分析结果。
<b>细胞实验：</b>	<b>Cell lines:</b> MDCK 细胞 <b>Concentrations:</b> 200 nM <b>Incubation Time:</b> 18 小时 <b>Method:</b> MDCK 细胞按每孔 1×10 <sup>3</sup> 个细胞接种在 24 孔板中, 加入 10%FBS, 在 37°C 温育 1 周。加入 HGF (90 ng/ml) 和不同浓度的 SGX523, 细胞再温育 18 小时。为了研究细胞迁移, A549 细胞按每孔 6×10 <sup>4</sup> 个细胞接种在 12 孔板上。用吸管刮痕在单分子膜上形成通道。加入不同浓度的 SGX523。24 小时后, 检测细胞迁移。
<b>动物实验：</b>	<b>Animal Models:</b> 皮下注射 GTL16, U87, 或 H441 细胞的雌性 Harlan 裸鼠 <b>Formulation:</b> 0.5% MC 400 with 0.05% Tween 80 <b>Dosages:</b> 60 mg/kg <b>Administration:</b> 口服饲喂

**【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 <sup>2</sup> )	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。