

SU-11274 ; SU11274

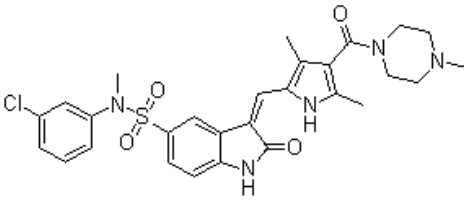
产品编号：MB3143

质量标准：>98%，选择性的 Met 抑制剂

包装规格：5MG;25MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C28H30ClN5O4S	结构式	
分子量	568.09		
CAS No.	658084-23-2		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 92 mg/mL (161.94 mM) Water : Insoluble Ethanol : 2 mg/mL (3.52 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：SU11274 是一种选择性的 Met 抑制剂，IC₅₀ 值为 10 nM，对 PGDFR β ，EGFR 或 Tie2 没有抑制作用。

别名：PKI-SU11274；

SU11274 (3Z)-N-(3-Chlorophenyl)-3-((3,5-dimethyl-4-[(4-methylpiperazin-1-yl)carbonyl]-1H-pyrrol-2-yl)methylene)-N-methyl-2-oxo-2,3-dihydro-1H-indole-5-sulfonamide

物理性状及指标：

外观：.....粉末

溶解性：.....DMSO : 92 mg/mL (161.94 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 2 mg/mL (3.52 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	SU11274 是一种选择性 Met 抑制剂，在无细胞试验中 IC ₅₀ 为 10 nM，对 PGDFR β ，EGFR 和 Tie2 没有作用。
靶点	Met (Cell-free assay) 0.01 μ M
体外研究	SU11274 作用于 Met 时，选择性比作用于 Flk 时选择性高 50 倍，比作用于其他酪氨酸激酶，如 FGFR-1, c-src, PDGFbR, 和 EGFR 时选择性高 500-1000 倍。SU11274 抑制 PI3K 通路关键调节器的磷酸化，包括 AKT, FKHR,或 GSK3 β 。在白细胞介素-3 存在时，SU11274 处理，抑制 TPR-MET 转化的 BaF3 细胞生长，这种作用存在剂量依赖性，IC ₅₀ <3 μ M，不会抑制

	其他致癌酪氨酸激酶转化的 BaF3 细胞生长, 包括 BCR-ABL, TEL-JAK2, TEL-ABL,和 TEL-PDGFR。除了抑制细胞生长, SU11274 处理, 也显著抑制 BaF3.TPR-MET 细胞迁移, 按 1 μM 和 5 μM 处理, 抑制分别为 44.8% 和 80%。SU11274 抑制 HGF 依赖的 Met 磷酸化, 及 HGF 依赖的细胞增殖和活动, IC50 为 1-1.5 μM。SU11274 作用于具有功能性 Met 受体的 H69 和 H345 细胞, 抑制 HGF 诱导的细胞生长, IC50 分别为 3.4 μM 和 6.5 μM。5 μM SU11274 处理, 使细胞周期停在 G1 期, 使 G1 期细胞从 42.4% 提高到 70.6%, 且诱导 caspase 依赖性凋亡, 按 1 μM 处理, 凋亡达 24%。SU1127 作用于表达 c-Met 的非小细胞肺癌(NSCLC)细胞, 抑制细胞活力, IC50 为 0.8-4.4 μM, 且废除肝脏生长因子诱导的 c-Met 及其下游信号磷酸化。
--	---

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。SU11274 是一种选择性的 Met 抑制剂, 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		1.7603 mL	8.8014 mL	17.6028 mL
5 mM		0.3521 mL	1.7603 mL	3.5206 mL
10 mM		0.1760 mL	0.8801 mL	1.7603 mL
50 mM		0.0352 mL	0.1760 mL	0.3521 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验 :	<p>体外 Met 激酶实验 : 构建含人 c-Met 胞浆域与谷胱甘肽 S-转移酶(GST)融合的嵌合蛋白 然后在 SF9 细胞中表达。使用 c-Met 激酶 GST 融合蛋白进行 ELISA 为基础的 Met 生化实验, 使用随机共聚物聚(Glu:Tyr)(4:1)固定在微孔板上, 作为底物。使用不同浓度 SU11274 在含 5 μM ATP, 10 mM MnCl₂, 50 mM HEPES (pH 7.5), 25 mM NaCl, 0.01% BSA, 和 0.1 mM 原钒酸钠 的 buffer 中测定 IC50 值。激酶反应在室温下进行 5 分钟。使用辣根过氧化物酶标记的抗-pTyr 抗体测定底物磷酸化的程度。</p>
细胞实验 :	<p>Cell lines: BaF3.TPR-MET, H69 和 H345 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为~10 μM Incubation Time: 24, 48, 和 72 小时 Method: 使用不同浓度 SU11274 处理细胞 24, 48, 和 72 小时。通过 MTT 实验或台酚蓝染色测定存活细胞数。进行荧光激活细胞分选分析, 通过通过碘化丙啶染色和膜联蛋白 V 阳性染色分别测定细胞周期和凋亡。</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。