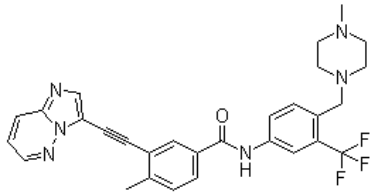
Ponatinib；AP24534

产品编号：MB3311
质量标准：98%，多靶点激酶抑制剂
包装规格：10MG;50MG;200MG
产品形式： powder

基本信息

分子式	C29H27F3N6O	结构式	
分子量	532.56		
CAS No.	943319-70-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：30 mg/mL (56.33 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：帕纳替尼 Ponatinib 是一种有效的，可口服的多靶点激酶抑制剂，抑制 Abl，PDGFRα，VEGFR2，FGFR1 和 Src 的 IC_{50} 分别为 0.37 nM， 1.1 nM，1.5 nM，2.2 nM 和 5.4 nM。

别名：AP 24534; AP-24534; AP-24534;3-(2-Imidazo[1,2-b]pyridazin-3-ylethynyl)-4-methyl-N-[4-[(4-methyl-1-piperazinyl)methyl]-3-(trifluoromethyl)phenyl]benzamide

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：30 mg/mL (56.33 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

产品描述	Ponatinib (AP24534)是一种新型有效的多靶点抑制剂，在无细胞试验中作用于 Abl，PDGFRα，VEGFR2，FGFR1 和 Src，IC50 分别为 0.37 nM，1.1 nM，1.5 nM，2.2 nM 和 5.4 nM。
靶点	Abl (Cell-free assay): 0.37 nM; PDGFRα (Cell-free assay): 1.1 nM; VEGFR2 (Cell-free assay): 1.5 nM; FGFR1 (Cell-free assay): 2.2 nM; c-Src (Cell-free assay): 5.4 nM
体外研究	Ponatinib 是有效的可用于口服的多靶点激酶抑制剂，作用于野生型细胞,及 T315I 突变细胞

	IC50 分别为 1.2 和 8.8nM。 Ponatinib 抑制 Ba/F3 衍生细胞系的增殖。Ponatinib 作用于表达野生型或 T315I 突变型 BCR-ABL 的 CML 细胞系，有效抑制 BCR-ABL 调节的信号。Ponatinib 阻断在细胞瘤筛选时产生抗性突变。Ponatinib 也抑制 VEGFR 和 FGFR 家族激酶，在体外抑制 FLT3, KIT, FGFR1,和 PDGFRa 激酶活性时 IC50 分别为 13, 13, 2, 和 1 nM. Ponatinib 抑制全部 4 种 RTKs 磷酸化，存在剂量依赖性，IC50 值为 0.3 到 20 nM。然而，Ponatinib 抑制表达野生型 FLT3 的 RS4;11 细胞时 IC50>100 nM。
体内研究	Ponatinib 抑制取自 FLT3-ITD 阳性 AML 病人的原代白血病细胞，而不抑制表达阴性 FLT3 的 AML 病人的白血病细胞。

美仑相关产品推荐

MB3947	CP-673451
MB2752	Crenolanib (CP868596)
MB3158	阿帕替尼甲磺酸盐
MB3992	瓦他拉尼(PTK787）2HCl

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。帕纳替尼 Ponatinib 是一种有效的多靶点激酶抑制剂，可作为白血病及相关癌症治疗等领域的科研试剂。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8777 mL	9.3886 mL	18.7772 mL
5 mM	0.3755 mL	1.8777 mL	3.7554 mL
10 mM	0.1878 mL	0.9389 mL	1.8777 mL
50 mM	0.0376 mL	0.1878 mL	0.3755 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	激酶实验: 通过同质时间分辨荧光共振能量转移法(TR-FRET)，使用纯化的人类野生型 ABL 激酶，T315I 突变型 ABL 激酶，及生物素化的磷酸激酶底物肽: 生物素-EKKMAAEAIYAAPFAK-NH2，测定野生型 ABL 和 T315I 突变型 ABL 活性的抑制激酶反应在全 LANCE 激酶 buffer (LKB)中进行 ,LKB 包括 20 mM NaHEPES(pH 为 7.4), 0.1 mg／mL BSA, 1 mM ATP, 10 mM MgCl2, 及 0.41 mM DTT，在提前用 1% BSA（溶于 PBS）包被的 96 孔板上 4oC 下过夜。用于激酶反应，Ponatinib 稀释物和野生型 ABL, T315I 突变型 ABL (40 pM), 及底物肽(50 nM), 在室温下温育 1 小时（T315I 突变型 ABL）或 2 小时（野生型 ABL）。加入 15 nM 抑制剂, 6 nM 铕标记的磷酸酪氨酸抗体（磷酸化位点在第 66 为酪氨酸上），及 60 nM 别藻蓝素标记的链酶亲和素，终止反应。实验板在室温下黑暗温育 20 分钟，使用 Wallac Victor2V 读数器读取 615 和 665nm 处的荧光值。在孔中数据平均值中插入抑制剂的 3 倍连续稀释液，再读取 665nm 处荧光值，计算 IC50 值。
细胞实验：	Cell lines: Ba／F3 细胞 Concentrations: 0-625 nM, 和 0-10 μM

	Incubation Time: 72 小时 Method: Ba/F3 细胞系按每孔 4×103 个细胞分布在 96 孔板上(4×103)，和梯度浓度 Ponatinib 温育 72 小时。Ponatinib 浓度范围为: 0-625 nM 作用于表达 BCR-ABL 细胞 ,0-10 μM 用于测定 BCR-ABL 阴性细胞。使用 MTS 实验测定细胞增殖，取三次平行实验平均值测定 IC50 值。 (Only for Reference)
动物实验：	Animal Models: 皮下植入 MV4-11 细胞移植瘤(1×107 ,50%基质胶中) 的雌性 CB.17 SCID 鼠 Formulation: 25 mmol/L 柠檬酸盐缓冲液(pH 为 2.75) Dosages: 每天处理一次，持续 4 周 Administration: 口服饲喂处理

【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。