

VS-6063 ; PF-04554878 ; Defactinib

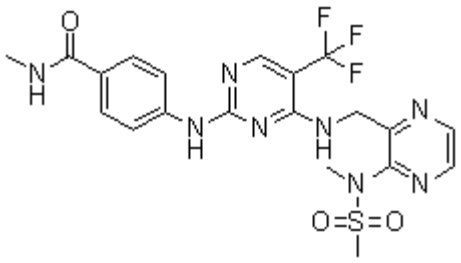
产品编号：MB3324

质量标准：>98%,FAK 激酶磷酸化抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C20H21F3N8O3S	结构式	
分子量	510.49		
CAS No.	1073154-85-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 5 mg/mL warmed (9.79) 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：Defactinib 是一种新型 **FAK** 抑制剂，抑制 FAK 在 Tyr397 位点磷酸化，这种作用具有时间和剂量依赖性。

别名：VS-6063; PF-04554878 ; Benzamide,

N-methyl-4-[[4-[[[3-[methyl(methylsulfonyl)amino]-2-pyrazinyl]methyl]amino]-5-(trifluoromethyl)-2-pyrimidinyl]amino]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 5 mg/mL warmed (9.79 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

作用机理：

本品能够以 AKT 依赖性的方式，通过降低 YB-1 磷酸化和随后的 CD44，增强紫杉类耐药性细胞的化学敏感性。以时间和剂量依赖性的方式，在 Tyr397 位点抑制 FAK 磷酸化。RPPA 数据显示，本品能够减少紫杉类耐药性细胞株中 AKT 和 YB-1 蛋白的水平。

生物活性

产品描述	Defactinib (VS-6063, PF-04554878)是一种选择性，且口服有效的 FAK 抑制剂。
靶点	FAK
体外研究	在紫杉醇敏感的(SKOV3ip1)和紫杉醇耐药的(SKOV3-TR)细胞系中,VS-6063显著抑制pFAK(Tyr397)表达。VS-6063和紫杉醇结合协同减少增殖,增加SKOV3ip1,SKOV3-TR,HeyA8和HeyA8-MDR细胞的凋亡。VS-6063和Y15结合协同降低甲状腺癌细胞系的生存能力,集落形成,和细胞黏附。

体内研究	在 PTX 敏感和 PTX 耐药模型中, VS-6063 (50 mg/kg p.o.)与紫杉醇合用增强生长抑制作用。
-------------	---

美仑相关产品推荐

MB1178	紫杉醇
MB1178-S	紫杉醇 (标准品)
MB3966	PF-00562271
MB2682	PF-562271
MB3968	PF-573228
MB3965	TAE226 (NVP-TAE226)

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。本品是一种强效的 FAK 激酶磷酸化抑制剂，能通过 AKT 依赖性通路克服 YB1 介导的紫杉醇耐药性。本品和紫杉醇结合应用，显著降低了细胞增殖，加速了细胞凋亡，使肿瘤重量减少了 92.7%到 97.9%。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9589 mL	9.7945 mL	19.5890 mL
5 mM	0.3918 mL	1.9589 mL	3.9178 mL
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验：	Cell lines: SKOV3ip1, SKOV3-TR, HeyA8 和 HeyA8-MDR 细胞 Concentrations: ~10 μ M Incubation Time: 96 小时 Method: 卵巢癌细胞用逐渐增加浓度的 VS-6063 处理 96 小时，然后进行 MTT 测定。结果通过重复三次实验证实。
动物实验：	Animal Models: 负荷 SKOV3ip1, SKOV3-TR, HeyA8 或 HeyA8-MDR 肿瘤的小鼠 Formulation: PBS Dosages: 50 mg/kg Administration: p.o.

【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。