

Crizotinib HCl ; PF-02341066 HCl ; 克里唑替尼盐酸 ; 克里唑替尼盐酸

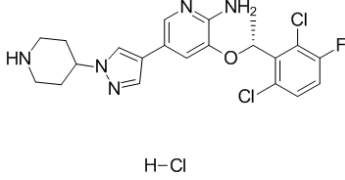
产品编号 : MB3593

质量标准 : >99%,MET 抑制剂

包装规格 : 20MG

产品形式 : 固体

基本信息

分子式	C21H22Cl2FN5O.HCl	结构式	 <p>H-Cl</p>
分子量	486.80		
CAS No.	1415560-69-8		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : ≥ 4.9 mg/mL (10.07 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 : 克里唑替尼盐酸 Crizotinib hydrochloride 是有效的 c-Met 和 ALK 抑制剂, 在细胞试验中, IC₅₀ 值分别为 11 nM 和 24 nM。

别名 : PF-02341066 hydrochloride ; Crizotinib hydrochloride ; Crizotinib HCl ; 克里唑替尼盐酸 ; 克里唑替尼盐酸

物理性状及指标 :

外观 :黄色至棕色固体

溶解性 :DMSO : ≥ 4.9 mg/mL (10.07 mM)

含量 :>99%

储存条件 : -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Crizotinib hydrochloride 是有效的 c-Met 和 ALK 抑制剂, 在细胞试验中, IC ₅₀ 值分别为 11 nM 和 24 nM。
靶点	IC50: 11 nM (c-Met), 24 nM (ALK)
体内研究	PF-2341066 在 mIMCD3 小鼠或 MDCK 犬上皮细胞中显示出相似的针对 c-Met 磷酸化的效力, IC50 分别为 5nM 和 20nM。 PF-2341066 示出了改进的或针对工程改造以表达 c-Met 的 ATP 结合位点的突变体 V1092I 或 H1094R 或具有 19 纳米, 2 和 15nM 的 IC50 P-环突变体 M1250T NIH3T3 细胞相似的活性, 分别与 NIH3T3 细胞相比表达野生型受体, IC50 为 13 nM。相反, 与野生型受体相比, 观察到针对经工程改造以表达 c-Met 活化环突变体 Y1230C 和 Y1235D 的细胞的 PF-2341066 效力的显著变化, IC50 分别为 127nM 和 92nM。 PF-2341066 还有效地阻止 NCI-H69 和 HOP92 细胞中 c-Met 的磷酸化, IC50 分别为 13nM 和 16nM, 其分别表达内源性 c-Met 变体 R988C 和 T1010I。 PF-2341066 还有效抑制 Karpas299 或 SU-DHL-1 ALCL 细胞中的 NPM-ALK 磷酸化, IC50 为 24 nM。 PF-2341066 有效地阻止细胞增殖, 其与 ALK 阳性

	ALCL 细胞中的 G (1) -S 期细胞周期停滞和诱导凋亡相关, IC50 为 30nM, 但不是 ALK 阴性淋巴瘤细胞。此外, PF-2341066 预防与原发肿瘤生长 (即增殖和存活) 以及转移相关的骨肉瘤行为。
体外研究	PF-2341066 揭示了在 50 mg/kg/day 和 75 mg/kg/day 治疗组中, 能够引起大肿瘤 (> 600 mm ³) 显著消退, 在 GTL-16 模型中, 与 43 天给药计划相比, 平均肿瘤体积减少 60%。在另一项研究中, PF-2341066 表现出完全抑制 GTL-16 肿瘤生长 >3 个月的能力, 12 只小鼠中只有 1 只在 3 个月的治疗计划中肿瘤生长以 50mg /kg/d 显著增加。在 GTL-16 肿瘤中, cd31 阳性内皮细胞以 12.5 mg/kg/d、25 mg/kg/d、50 mg/kg/d 剂量依赖性显著降低, 说明抑制 MVD 与抗肿瘤疗效呈剂量依赖性相关。PF-2341066 显示, 在 GTL-16 和 U87MG 模型中, 人 VEGFA 和 IL-8 血浆水平的显著剂量依赖性降低。显著抑制磷酸化 c-Met, Akt、Erk PLCλ1, STAT5 水平观察 GTL-16 肿瘤后卖方 pf - 2341066。PF-2341066 可预防原发性肿瘤生长和转移引起的骨肉瘤行为。在经口服灌胃 PF-2341066 治疗的裸鼠中, PF-2341066 可阻止异种骨肉瘤的生长及相关骨溶解和骨外基质形成。用 50mg /kg PF-2341066 处理 c- met 扩增的 GTL-16 异种移植植物可导致肿瘤消退, 肿瘤消退与 18F-FDG 摄取缓慢降低和葡萄糖转运体 1、GLUT-1 表达降低有关。

美仑相关产品推荐

MB4161	(S)-crizotinib
MB2025	克里唑替尼; 克里唑替尼, Crizotinib

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。克里唑替尼盐酸 Crizotinib hydrochloride 是有效的 c-Met 和 ALK 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置:

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.0542 mL	10.2712 mL
5 mM	0.4108 mL	2.0542 mL	4.1085 mL
10 mM	0.2054 mL	1.0271 mL	2.0542 mL
50 mM	-	-	-

【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。