

NVP-AEW541

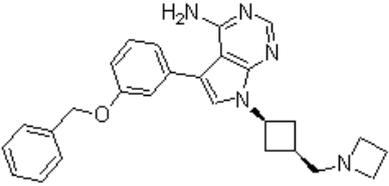
产品编号：MB3904

质量标准：>98%，有效的 IGF-1R 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C27H29N5O	结 构 式	
分子量	439.55		
CAS No.	475489-16-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 88 mg/mL (200.2 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： NVP-AEW541 是一种有效的 IGF-1R 抑制剂。

别名： AEW 541, AEW-541, AEW541 ,

7-[cis-3-(1-Azetidinylmethyl)cyclobutyl]-5-[3-(phenylmethoxy)phenyl]-7H-pyrrolo[2,3-d]-pyrimidin-4-amine

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 88 mg/mL (200.2 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	NVP-AEW541 是一种有效的 IGF-1R/InsR 抑制剂，在无细胞试验中 IC50 为 150 nM/140 nM，在细胞试验中对 IGF-1R 具有较高的作用和选择性。				
靶点	Insulin Receptor (Cell-free assay)	IGF-1R (Cell-free assay)	FLT3 (Cell-free assay)	Tek (Cell-free assay)	FLT1 (Cell-free assay)

	0.14 μ M	0.15 μ M	0.42 μ M	0.53 μ M	0.6 μ M
体外研究	在纯化的激酶/重组激酶域实验中，NVP-AEW541 也抑制 InsR, Tek, Flt1 和 Flt3，IC50 分别为 140 nM, 530 nM, 600 nM 和 420 nM。在细胞水平，NVP-AEW541 选择性更高，比 InsR 选择性高 27 倍。NVP-AEW541 抑制 IGF-I 调节的生存，软琼脂，和 MCF-7 细胞增殖，IC50 分别为 0.162 μ M, 0.105 μ M 和 1.64 μ M。NVP-AEW541 作用于 NWT-21 细胞，也降低 p-IGF-IR 和 p-PKB 水平。NVP-AEW541 作用于培养在低血清培养基和含 10% FBS 的培养基中的 TC-71 肌肉骨肉瘤细胞，抑制生长。NVP-AEW541 作用于肉瘤细胞系(TC-71, SK-N-MC, SaoS-2, RD/18 和 RH4)，抑制细胞周期进展和诱导细胞周期在 G1 期停顿。NVP-AEW541 可抑制神经母细胞瘤细胞生长,IC50 为 0.4-6.8 μ M。在这些细胞中可以检测到亚二倍体片段增多及 S 和 G2-M 期细胞消耗。在神经母细胞瘤细胞中，NVP-AEW541 驱动的 IGF-IR 受抑制，可降低 Akt 磷酸化,而不是 Erk1 和 Erk2 磷酸化。NVP-AEW541 抑制神经胶质瘤细胞生长，且破坏 HIF1 α 稳定化启动的自分泌环。最新研究显示 NVP-AEW541 抑制 PC3, DU145, 和 22Rv1 前列腺癌细胞增殖和活性。NVP-AEW541 作用于 22Rv1 和 DU415 细胞而不是 PC3 细胞，降低 p-Akt 水平，不会影响整体 Akt 水平，说明 PTEN 状态可决定 NVP-AEW541 的有效性。NVP-AEW541 诱导的放射敏感度决定于 Akt 激活状态。NVP-AEW541 作用于 PC3, DU145, 和 22Rv1 细胞，可提高 H2AX 磷酸化。				
体内研究	NVP-AEW541(50 mg/kg, 口服处理)作用于 NWT-21 移植瘤，导致基础型和 IGF-I 诱导型受体的废除，也抑制 PKB 和 MAPK 磷酸化，T/C 值为 14%。NVP-AEW541(50 mg/kg) 作用于 HTLA-230 和 SK-N-BE2c 移植瘤，引起肿瘤缩小，没有全身毒性迹象。NVP-AEW541 作用于 Matrigel 包被的细胞和 HTLA-230 移植瘤，可以抑制肿瘤入侵。				

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3955	OSI-906 (Linsitinib)
MB3909	PQ401
MB3905	BMS-754807
MB3908	GSK1838705A

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。NVP-AEW541 是一种有效的 IGF-1R 抑制剂。本品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	2.2751 mL	11.3753 mL	22.7505 mL
5 mM	0.4550 mL	2.2751 mL	4.5501 mL

10 mM	0.2275 mL	1.1375 mL	2.2751 mL
50 mM	0.0455 mL	0.2275 mL	0.4550 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	体外酶法测定: NVP-AEW541 溶解在 DMSO(10 mM) 中, 储存在-20oC 下。稀释液在 1:1 的 DMSO/水中现配。在酶法测定中 DMSO 的最终浓度 <0.5 %。蛋白激酶实验在 96 孔板上进行, 加入 20 μ l 125 mM EDTA 终止反应。随后, 30 μ l (c-Abl, c-Src, IGF-1R) 反应混合物转移到 Immobilon-P 转印膜上, 加入甲醇预浸泡 5 分钟,用水冲洗, 然后加入 0.5 % H3PO4 浸泡 5 分钟, 然后装在真空管中。识别所有样本后, 用 200 μ l 0.5 % H3PO4 冲洗每孔。分离膜, 在搅拌器上用 1.0 % H3PO4 冲洗 4 次, 其中一次加入乙醇。烘干后, 建立 Packard TopCount 96 孔框架, 每孔加入 10 μ l Microscint, 膜计数。通过线性回归分析 NVP-AEW541 在四种不同浓度(0.01, 0.1, 1, 和 10 μ M)下的抑制百分数来计算 IC50 值。37oC 下, 每分钟, 每毫克蛋白中, [γ 33P]ATP 转化到底物蛋白中的 1 nM 33P 表示蛋白激酶活性。
细胞实验	Cell lines: MCF-7 细胞 Concentrations: 30 到 300 nM Incubation Time: 30 分钟 Method: NVP-AEW541 直接加到琼脂培养基中, 最终浓度为 30 到 300 nM。MCF7 生长培养基中下层包括每孔 0.5 ml 细菌琼脂。包被培养板, 储存在孵育器中(37oC, 5% CO2)至少 30 分钟, 固定培养基, 然后加入上层琼脂。在生长培养基的 0.5ml 上层 0.4%琼脂中每孔接种 5×10^3 个 MCF-7 细胞。在 37oC, 5% CO2 环境下温育 3 周后, 细胞混合, 用结晶紫染色,计数阳性菌落(直径 >40 μ m),使用 KS-400 图像分析系统测定转化效率。
动物实验	Animal Models: 携带 NWT-21 细胞的 Harlan 无胸腺裸鼠, 体重为 18-25 g Formulation: 溶解在 25 mM L(+)-酒石酸 Dosages: 20, 30,或 50 mg/kg; 10 ml/kg Administration: 每天口服处理 2 次, 每周处理 7 天

【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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。