

BMS-754807

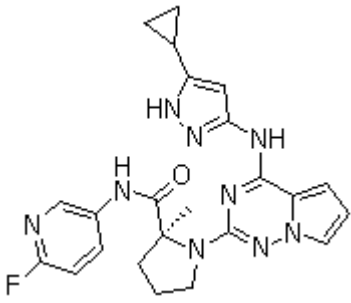
产品编号：MB3905

质量标准：>98%，IGF-1R/InsR 可逆抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C23H24FN9O	结 构 式	
分子量	461.49		
CAS No.	1001350-96-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO : 92 mg/mL (199.35 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 92 mg/mL (199.35 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：BMS-754807 是有效、可逆的胰岛素样生长因子 1 受体/胰岛素受体抑制剂，同时也抑制 Met，RON，TrkA，TrkB，AurA 和 AurB 的活性。

别名：(2S)-1-[4-[(5-Cyclopropyl-1H-pyrazol-3-yl)amino]pyrrolo[2,1-f][1,2,4]triazin-2-yl]-N-(6-fluoro-3-pyridinyl)-2-methyl-2-Pyrrolidinecarboxamide, BMS 754807

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：92 mg/mL (199.35 mM)；Water Insoluble；Ethanol：92 mg/mL (199.35 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	BMS-754807 是有效的 IGF-1R/InsR 可逆抑制剂，IC50 为 1.8 nM/1.7 nM, 对 Met, Aurora A/B, TrkA/B 和 Ron 作用效果稍弱,对 Flt3, Lck, MK2, PKA, PKC 等几乎没有抑制活性。				
靶点	IGF-1R	IR	Met	TrkA	TrkB

IC50	1.8 nM	1.7 nM	5.6 nM	7.4 nM	4.1 nM
体外研究	BMS-754807 有效抑制人类多种不同组织来源的肿瘤细胞系的生长，包括间充质（尤文氏肉瘤，横纹肌肉瘤，神经母细胞瘤，和脂肪肉瘤），上皮（乳腺，肺，胰腺，结肠，和胃），和造血（多发性骨髓瘤和白血病）组织，IC50 值从 5 nM 到 365 nM。BMS-754807 抑制 IGF-1R-Sal 细胞和 RH41 细胞增殖，IC50 分别为 7 nM 和 5 nM。BMS-754807 作用于 IGF-1R-Sal, Rh41 和 Geo 细胞，抑制 IGF-1R 磷酸化，IC50 分别为 13 nM, 6 nM 和 21 nM。BMS-754807 作用于 IGF-1R-Sal, Rh41 和 Geo 细胞，抑制 Akt 磷酸化，IC50 分别为 22 nM, 13 nM 和 16 nM。BMS-754807 诱导 Rh41 细胞凋亡。BMS-754807 作用于 IGF-Sal 细胞系，抑制 IGF-1R (IC50 = 13nM) 和下游靶点 Akt (IC50 = 22nM) 和 MAPK(IC50 = 13nM) 的磷酸化。在儿科临床前期试验计划（PPTP）中，BMS-754807 作用于 23 种细胞系，平均 EC50 值为 0.62 μM。				
体内研究	BMS-754807(12.5mg/kg,口服)作用于携带 IGF-1R-Sal 肿瘤的裸鼠，抑制肿瘤和血清中 IGF-1R 磷酸化。BMS-754807 作用于一组选定的上皮(IGF-1R-Sal, GEO, 和 Colo205)，造血（JJN3）和间质（RD1 和 Rh41）移植瘤模型，抑制肿瘤生长，肿瘤生长抑制率从 53%至 115%不等。BMS-754807 (6.25 mg/kg) 作用于转基因的 IGF-Sal 肿瘤小鼠模型，完全抑制肿瘤生长，且抑制 pIGF-1R 和 pAKT。BMS-754807 与小鼠血浆和人类血浆的蛋白结合率分别为 98.5% 和 95.9%。BMS-754807 (25 mg/kg)作用于携带 KT-5 (Wilms), KT-14 (rhabdoid), Rh28 (rhabdomyosarcoma), 和 OS-1 移植瘤的小鼠模型，显著抑制肿瘤。				
特征	胰岛素样生长因子-1R/IR 家族激酶的多重抑制剂				

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)

MB3904	NVP-AEW541
MB3955	OSI-906 (Linsitinib)
MB3909	PQ401

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。BMS-754807 是有效的 IGF-1R/InsR 可逆抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1669 mL	10.8345 mL	21.6689 mL
5 mM	0.4334 mL	2.1669 mL	4.3338 mL
10 mM	0.2167 mL	1.0834 mL	2.1669 mL

50 mM	0.0433 mL	0.2167 mL	0.4334 mL
-------	-----------	-----------	-----------

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	激酶抑制实验: 在体外激酶实验中使用重组人类 IGF-1 受体酶测定 BMS-754807，在生化实验中使用合成肽 KKSREGDYMTMQIG 作为磷酸受体底物测定 BMS-754807。在 Ubottom 384 孔板中使用 30 μ L 实验缓冲液 (100 mM Hepes pH 7.4, 10 mM $MgCl_2$, 0.015% Brij35 and 4 mM DTT)来进行酶活测定。通过结合 ATP, 1.5 μ M 荧光标记肽底物, 酶和 BMS-754807 而开始反应，反应持续 60 分钟。加入 EDTA 终止反应。通过电泳分离荧光底物和磷酸化产物，然后在 Caliper LabChip 3000 上分析反应混合物。通过对剂量反应曲线进行非线性回归分析而获得 IC50 值。
细胞实验	Cell lines: IGF-1R-Sal, RH41 和 Geo 细胞系 Concentrations: 365 nM Incubation Time: 72 小时 Method: 细胞按最佳密度培养在 RPMI + GLUTAMAX 培养基中，培养基中含有有 10% 热灭活的胎牛血清（FBS），10mMHepes，青霉素和链霉素。BMS-754807 处理细胞 72 小时后，通过测定 3H -胸苷渗透到 DNA 中的程度而测评细胞增殖。结果表示为 IC50。
动物实验	Animal Models: 携带 IGF-1R-Sal, GEO, Colo205, JJN3, RD1 或 Rh41 肿瘤的裸鼠 Formulation: 聚乙二醇 400 的混合物[PEG400/水(4:1; vol/vol)] Dosages: 150 mg/kg Administration: 口服

【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。