

## PQ-401 ; PQ401

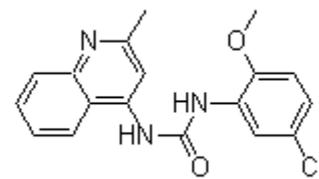
产品编号 : MB3909

质量标准 : >98% , 抑制 IGF-1R 区域自磷酸化

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C18H16ClN3O2	结 构 式	
分子量	341.79		
CAS No.	196868-63-0		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 32 mg/mL (93.62 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 :** PQ401 是 IGF1R 阻断剂, 能抑制 IGF1R 自磷酸化。

**别名 :** Urea, N-(5-chloro-2-methoxyphenyl)-N'-(2-methyl-4-quinolinyloxy)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 32 mg/mL (93.62 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C , 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	PQ 401 抑制 IGF-1R 区域自磷酸化, IC50 为低于 1 μM。
<b>靶点</b>	IGF-1R <1 μM
<b>体外研究</b>	PQ 401 是 IGF-1R 抑制剂, 浓度<100 nM 时, 抑制 IGF-IR 激酶域的自磷酸化, IC50 < 1μM. PQ 401 显著降低 MCF-7 细胞增殖, IC50 为 8 μM. PQ 401 也抑制 MCNeuA 细胞生长, IC50 为 15 μM. PQ 401 作用于 MCF-7 细胞, 抑制 IGF-I 调节的抗凋亡途径. PQ 401 作用于 MCF-7 细胞, 增强 caspase 调节的凋亡活性。

体内研究	PQ 401(50 mg/Kg,100 mg/Kg)显著抑制 MCNeuA 肿瘤生长，这种作用具有剂量依赖性。
------	---

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)

MB3905	BMS-754807
MB3908	GSK1838705A
MB3907	NVP-ADW742

**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。PQ401 是 IGF1R 阻断剂，能抑制 IGF1R 自磷酸化。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	2.9258 mL	14.6289 mL	29.2577 mL
5 mM	0.5852 mL	2.9258 mL	5.8515 mL
10 mM	0.2926 mL	1.4629 mL	2.9258 mL
50 mM	0.0585 mL	0.2926 mL	0.5852 mL

#### 经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	<p>IGF-IR 肽自磷酸化:</p> <p>1<math>\mu</math>g 组成型激活的 IGF-IR 激酶结构域肽与溶于 2%DMSO 的 +/- 不同浓度 PQ401 在 40 mM Tris (pH 7.4), 80<math>\mu</math>M EGTA, 0.25% 2-巯基乙醇, 80<math>\mu</math>M Na<sub>3</sub>VO<sub>4</sub>, 10 mM MgCl<sub>2</sub>, 和 2 mM MnCl<sub>2</sub> 中温育 20 分钟。然后加入终浓度为 20<math>\mu</math>M 的 ATP。激酶结构域肽的自磷酸化在 22<math>^{\circ}</math>C 下进行 20 分钟。加入 SDS-还原 Buffer 终止反应，然后样品在 SDS-PAGE 上跑胶。转移到硝酸纤维素膜上后，使用抗磷酸酪氨酸抗体 (PY20) 进行 Western blotting 而测定肽自磷酸化。</p>
细胞实验	<p><b>Cell lines:</b> MCF-7, MCNeuA</p> <p><b>Concentrations:</b> ~50 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 3 天</p> <p><b>Method:</b> 使用 CyQuant 细胞增殖检测试剂盒测定 Diaryl urea 抑制乳腺癌细胞生长的效果。MCF-7 或 MCNeuA 细胞按每孔 5<math>\times</math>10<sup>3</sup> 个细胞接种于 96 孔板中，孔中为补充 10% FCS 的无酚红 DMEM 培养基。每天制备一个实验板，用于收集。细胞粘附过夜，使用不同浓度 Diaryl urea 处理，或 DMSO 处理作为空白对照。在实验第 0, 1, 2, 和 3 天，通过反相微孔板到纸巾上收集微孔板培养物，使用温和印迹去除生长培养基，而不破坏贴壁细胞。每组实验板储存在 -80<math>^{\circ}</math>C 下，直到实验末期 (第 3 天)，所有实验板解冻，一起检测。解冻后，每孔加入 200 <math>\mu</math>L</p>

	CyQuant GR 溶液，实验板在黑暗中温育 2 到 5 分钟。使用 SpectraMax Gemini XS 荧光酶标仪在 480-nm(激发)和 520-nm(发射)处测量荧光值。计算增殖指数，作为实验第 0 天，核苷酸含量与对照细胞的百分比。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 注射 MCNeuA 细胞的 FVB/N-TgN(MMTVneu)202 小鼠 <b>Formulation:</b> 8% 聚山梨酯 80 和乙醇 <b>Dosages:</b> 50 或 100 mg/kg <b>Administration:</b> 腹腔注射

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。