

## Quizartinib (AC220)

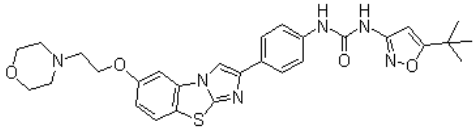
产品编号：MB3910

质量标准：>98%，FLT3 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C29H32N6O4S	结 构 式	
分子量	560.67		
CAS No.	950769-58-1		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：33 mg/mL (58.85 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：**奎扎替尼 Quizartinib (AC220) 是一种有效的 Flt3 酪氨酸激酶抑制剂。

**别名：**AC220；AC-220；N-(5-tert-Butylisoxazol-3-yl)-N'-(4-[7-(2-morpholin-4-ylethoxy)imidazo[2,1-b][1,3]benzothiazol-2-yl]phenyl)urea

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：33 mg/mL (58.85 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>	Quizartinib (AC220)是一种二代 FLT3 抑制剂，作用于 Flt3(ITD/WT)，在 MV4-11 和 RS4;11 细胞中 IC50 分别为 1.1 nM/4.2 nM，作用于 Flt3 比作用于 KIT，PDGFRA，PDGFRB，RET，和 CSF-1R 选择性高 10 倍。	
<b>特性</b>	AC220 是二代 FLT3 抑制剂，且作为临床 FLT3 抑制剂的第一候选药。	
<b>靶点</b>	FLT3 (ITD) (MV4-11 cells)	FLT3 (WT) (RS4;11 cells)

	1.1 nM	4.2 nM
<b>体外研究</b>	AC220 是最有效的 FLT3 选择性抑制剂，可用于治疗急性骨髓性白血病(AML)。AC220 在生化和细胞实验中具有低纳摩尔效果和特别的激酶选择性，抑制大部分人类蛋白激酶时具有高选择性。AC220 是治疗急性骨髓性白血病(AML)的新型 FLT3 抑制剂。	
<b>体内研究</b>	AC220 作用于移植瘤模型，具有好的药品属性，极高的药效和耐受性。在体内，AC220 作用于 FLT3-ITD AML 鼠模型，抑制 FLT3 活性,明显延长寿命；作用于依赖 FLT3 的移植瘤鼠模型时，根除肿瘤；作用于病人原代细胞时，有效抑制 FLT3 活性。	

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)

MB3913	TCS359
MB4352	UNC2025
MB5456	SB1317,TG02

**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。Quizartinib (AC220)是一种二代 FLT3 抑制剂，作用于 Flt3(ITD/WT)，作用于 Flt3 比作用于 KIT，PDGFRA，PDGFRB，RET，和 CSF-1R 选择性高 10 倍。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	1.7836 mL	8.9179 mL	17.8358 mL
5 mM	0.3567 mL	1.7836 mL	3.5672 mL
10 mM	0.1784 mL	0.8918 mL	1.7836 mL
50 mM	0.0357 mL	0.1784 mL	0.3567 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p>激酶实验: 为了测定 AC220 抑制无靶点激酶的效果，为了比较 AC220 和其他 FLT 抑制剂的选择性,使 AC220 作用于 KinomeScan 一组 402 种激酶进行结合试验，其中 80%为典型的人类蛋白激酶。测定所有激酶的解离常数。计算绝对选择性和作用于 FLT 的相对选择性。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> MV4-11 和 RS4;11 细胞 <b>Concentrations:</b> 0-100 nM <b>Incubation Time:</b> 72 小时，及 2 小时 <b>Method:</b> 在增殖实验中，细胞培养在低血清培养基(含 0.5% FBS)中过夜，然后按每孔 <math>4 \times 10^4</math> 个细胞接种在 96 孔板上，然后加入 AC220，37oC 下温育 72 小时。测定细胞活力。测定抑制</p>

	FLT3 自磷酸化的效果, 细胞培养在低血清培养基(含 0.5% FBS)过夜, 然后按每孔 $4 \times 10^5$ 个细胞接种在 96 孔板上。细胞和 AC220 一起在 37°C 下温育 2 小时, 诱导 RS4;11 细胞中 FLT3 自磷酸化, 加入 100 ng/mL FLT3 配位体, 持续 15 分钟。转移细胞溶解物到用 FLT3 抗体包被的 96 孔板上。然后加入作用于 FLT3 的生物素化抗体, 测定全部 FLT3, 或者作用于磷酸酪氨酸的抗体, 测定 FLT3 自磷酸化。使用 SULFO 标记的链霉亲和素二抗进行电化学发光测定。
动物实验	<b>Animal Models:</b> 雌性裸鼠或严重联合免疫缺陷鼠 <b>Formulation:</b> 22%羟丙基- $\beta$ -环糊精 <b>Dosages:</b> 10 mL/kg <b>Administration:</b> 口服饲喂处理

**【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(M <sup>2</sup> )	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。