

R-428 (BGB324) ; R428 (BGB324)

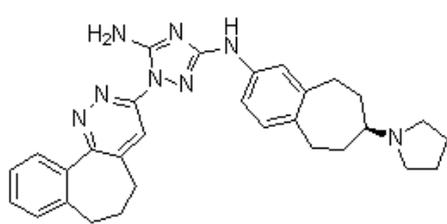
产品编号 : MB3917

质量标准 : >98% , Axl 抑制剂

包装规格 : 1MG;5MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C30H34N8	结 构 式	
分子量	506.64		
CAS No.	1037624-75-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 6 mg/mL warmed (11.84 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 : R428 是一种高效的具有选择性的 Axl 抑制剂。

别名 : R428; BGB324 ; 1H-1,2,4-Triazole-3,5-diamine, 1-(6,7-dihydro-5H-benzo[6,7]cyclohepta[1,2-c]pyridazin-3-yl)-N3-[(7S)-6,7,8,9-tetrahydro-7-(1-pyrrolidinyl)-5H-benzocyclohepten-2-yl]-

物理性状及指标 :

外观 :类白色至黄色固体

溶解性 :DMSO 6 mg/mL warmed (11.84 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

产品描述	R428 是 Axl 抑制剂, IC50 为 14 nM, 作用于 Axl 比作用于 Abl 选择性高 100 倍以上。作用于 Axl 选择性也比作用于 Mer 和 Tyro3(高 50 到 100 倍)及 InsR, EGFR, HER2, 和 PDGFRβ(高 100 倍以上)高。
靶点	Axl

IC50	14 nM
体外研究	R428 阻断 Axl 的催化和前癌活性。纳摩尔级 R428 抑制 Axl 活性并阻断 Axl 依赖的过程，包括 Akt 磷酸化, 乳腺癌细胞入侵以及促炎细胞因子产生。最近一项研究表明 Axl 抑制剂 R428 对原发性 CLL B 细胞处理 24 小时后平均 IC50 约为 2.0 μ M，而类似条件下正常的 B 细胞, T 细胞和自然杀伤细胞(NK) 在 R428 (2.5 μ M)浓度时没有明显的细胞死亡
体内研究	药理学研究表明口服 R428 治疗后可以降低肿瘤中巨噬细胞集落刺激因子和上皮间质转化的转录调节因子 Snail 的表达，这种作用具有剂量依赖特性。R428 在角膜微囊和肿瘤模型中抑制血管新生，这支持了之前的一项研究。在 MDA-MB-231 心内和 4T1 原位乳腺癌转移小鼠模型中，R428 治疗可以减轻癌细胞转移负担并延长生存期 (与对照组 52 天相比中位生存期大于 80 天，P < 0.05)

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)

MB4543	TP-0903
--------	---------

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。R428 是一种高效的具有选择性的 Axl 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	1.9738 mL	9.8689 mL	19.7379 mL
5 mM	0.3948 mL	1.9738 mL	3.9476 mL
10 mM	0.1974 mL	0.9869 mL	1.9738 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	体外激酶分析： 在体外激酶放射性测量分析中进行 R428 的五点剂量滴定。同时利用荧光偏振法进行 Axl, Mer 和 Tyro3 的分析。利用 Z
细胞实验：	Cell lines: MDA-MB-231 或者 4T1 细胞 Concentrations: 0.03, 0.3, 3 μ M Incubation Time: 3 小时

	<p>Method:</p> <p>在 37 °C 条件下让 MDA-MB-231 或 4T1 细胞从基质胶沿着 24 孔 Transwell 培养板的 8 微米气孔迁移到 20% FCS , 迁移时间 16 到 24 小时。将未迁移走的细胞和基质胶擦除掉。侵入的细胞用 4% 甲醛固定, 1% 结晶紫染色然后定量用于基于细胞的 Axl 分析。细胞先与 R428 预孵育 3 小时。 Transwell 培养室上部和下部都加入 R428 。</p>
<p>动物实验 :</p>	<p>Animal Models: 心脏内含有 MDA-MB-231-luc-D3H2LN 细胞的动物模型</p> <p>Formulation: 0.5% 羟丙基甲基纤维素 + 0.1% 吐温 80</p> <p>Dosages: 125 mg/kg</p> <p>Administration: 口服, 一天两次</p>

【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。