

Bafetinib ; INNO-406

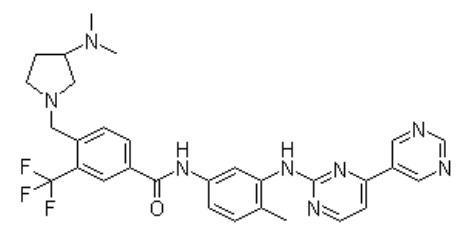
产品编号 : MB3919

质量标准 : >98% , 双重 Bcr-Abl/Lyn 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C30H31F3N8O	结构式	
分子量	576.62		
CAS No.	859212-16-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (173.42 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 : 巴氟替尼 Bafetinib 是具有抗肿瘤活性的 Lyn/Bcr-Abl 酪氨酸激酶抑制剂。

别名 : INNO-406; NS-187 ; 巴非替尼; N-[3-([4,5'-bipyrimidin]-2-ylamino)-4-methylphenyl]-4-[[[3S]-3-(dimethylamino)-1-pyrrolidinyl]methyl]-3-(trifluoromethyl)benzamide

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (173.42 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	Bafetinib (INNO-406) 是有效的, 选择性的, 双重 Bcr-Abl/Lyn 抑制剂, IC50 为 5.8 nM/19 nM, 对 T315I 突变型的磷酸化没有抑制作用, 对 PDGFR 和 c-Kit 的作用效果稍弱。	
靶点	Abl	Lyn
IC50	5.8 nM	19 nM

体外研究	Bafetinib 抑制 Abl 和 Lyn, IC50 分别为 5.8 nM 和 19 nM。此外, Bafetinib 抑制 WT Bcr-Abl 自磷酸化, 也抑制其下游激酶活性, 作用于 K562 和 293T 细胞时, IC50 分别为 11 nM 和 22 nM。在体外, Bafetinib 抑制 Bcr-Abl 阳性细胞系生长, 包括 K562, KU812, 和 BaF3/wt 细胞, 而对 Bcr-Abl-阴性 U937 细胞系增殖没有作用效果。而且, Bafetinib 作用于 Bcr-Abl 点突变细胞系, 如 BaF3/E255K 细胞, 具有抗增殖效果, 这种作用具有剂量依赖性。[Bafetinib 作用于 Bcr-Abl+白血病细胞系, 通过抑制 Bcr-Abl 磷酸化, 诱导 caspase 调节的和 caspase 非依赖的细胞死亡。
体内研究	Bafetinib 每天按 0.2 mg/kg 剂量作用于 Bcr-Abl 阳性 KU812 小鼠模型, 显著抑制肿瘤生长, 按 20 mg/kg 剂量处理, 完全抑制肿瘤生长, 且没有副作用。Bafetinib 按 30 mg/kg 剂量作用于 Balb/c 小鼠, 所具有的药理学参数如下: Tmax, 2 小时; 最大浓度值, 661 ng/mL; T1/2, 1 小时; 最大耐药剂量, 200 mg/kg/d; 生物药效率(BA), 32%。
特征	Bafetinib 是有效的双重 Bcr-Abl/Lyn 酪氨酸激酶选择性抑制剂。

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)

MB3956	DCC-2036 (Rebastinib)
MB3957	GNF-2
MB3959	PD173955

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。Bafetinib (INNO-406) 是有效的, 选择性的, 双重 Bcr-Abl/Lyn 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	1.7342 mL	8.6712 mL	17.3424 mL
5 mM	0.3468 mL	1.7342 mL	3.4685 mL
10 mM	0.1734 mL	0.8671 mL	1.7342 mL
50 mM	0.0347 mL	0.1734 mL	0.3468 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	激酶实验: 在含 250 μM 肽底物, 740 Bq/μL [γ- ³³ P]ATP, 及 20 μM 冰冻 (ATP) 的 25 μL 反应混合物中, 使用 SignaTECT 蛋白酪氨酸激酶实验系统, 进行 Bcr-Abl 激酶实验。使用浓度为 10 nM 的每种 Bcr-Abl 激酶。使用酶联免疫吸附试验(ELISA)试剂盒, 进行 Abl, Src, 和 Lyn 激酶实验。
-------------	--

	使用 KinaseProfiler 测定 Bafetinib 抑制 79 种酪氨酸激酶的效果。
细胞实验	<p>Cell lines: K562, BaF3/wt, BaF3/E255K, 和 BaF3/T315I</p> <p>Concentrations: 0 到 10 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: K562, BaF3/wt, BaF3/E255K,和 BaF3/T315I 细胞按每孔 1×10^3 个细胞一式三份接种在 96 孔板上, 而 KU812 和 U937 细胞按每孔 5×10^3 个细胞一式三份接种在 96 孔板上。细胞与梯度稀释的 Bafetinib 温育 3 天。通过 MTT 检测实验测定细胞增殖, 拟合对数曲线数据, 计算 IC50 值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 通过皮下注射 KU812 细胞到 Balb/c-nu/nu 雌鼠的右侧而建立 KU812 移植瘤</p> <p>Formulation: 溶于 0.5%甲基纤维素</p> <p>Dosages: ≤ 20 mg/kg/day</p> <p>Administration: 口服处理</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。