

Amuvatinib ; MP-470

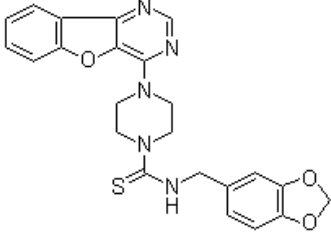
产品编号 : MB3949

质量标准 : >98% , c-Kit , PDGFR α 和 Flt3 多靶点抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H21N5O3S	结 构 式	
分子量	447.51		
CAS No.	850879-09-3		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 32 mg/mL (71.5 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 : Amuvatinib (MP-470)是多靶点抑制剂, 作用于 c-Kit(D816H), PDGFR α (V561D)和 FLT3(D835Y)。

别名 : MP470; HPK 56 ; 1-Piperazinecarbothioamide, N-(1,3-benzodioxol-5-ylmethyl)-4-benzofuro[3,2-d]pyrimidin-4-yl

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO 32 mg/mL (71.5 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	Amuvatinib (MP-470)是一种有效的, 作用于 c-Kit , PDGFR α 和 Flt3 的多靶点抑制剂, IC50 分别为 10 nM , 40 nM 和 81 nM。Phase 2。		
靶点	c-Kit (D816H)	PDGFR α (V561D)	FLT3 (D835Y)

	10 nM	40 nM	81 nM
体外研究	MP-470 作用于 MiaPaCa-2, PANC-1, 和 GIST882 细胞, 具有毒性, IC50 为 1.6 μ M 到 3.0 μ M。MP-470 也结合且抑制一些 c-Kit 突变型, 包括 c-Kit ^{K642E} , c-Kit ^{D816V} , 和 c-Kit ^{K642E/D816V} 。MP-470 的盐酸盐也抑制一些 c-Kit 突变型, 包括 c-Kit ^{D816V} , c-Kit ^{D816H} , c-Kit ^{V560G} , 和 c-Kit ^{V654A} , 及 Flt3 突变型(Flt3 ^{D835Y}) 和两种 PDGFR α 突变型 (PDGFR α ^{V561D} 和 PDGFR α ^{D842V}), IC50 为 10 nM 到 8.4 μ M。MP-470 盐酸盐有效抑制 OVCAR-3, A549, NCI-H647, DMS-153, 和 DMS-114 细胞增殖, IC50 为 0.9 μ M–7.86 μ M。MP-470 (1 μ M) 作用于 MDA-MB-231 细胞, 抑制 AXL 的酪氨酸磷酸化。MP-470 作用于 LNCaP 和 PC-3, 而不是 DU145 细胞, 具有毒性, IC50 分别为 4 μ M 和 8 μ M, 且在 10 μ M 处有点增殖。MP-470 (10 μ M) 作用于 LNCaP 细胞, 使细胞周期在 G1 期停滞, 且降低 Akt 和 ERK1/2 磷酸化。MP-470 (10 μ M) 作用于 SF767 细胞, 抑制 c-Met 磷酸化, 且使细胞对 辐射敏感。MP-470 (10 μ M) 和辐射联合处理, 抑制 GSK-3 β 活性, 诱导凋亡, 且可能通过抑制 Rad51 而破坏 dsDNA b 断裂修复。		
体内研究	MP-470(10 mg/kg-75 mg/kg 通过腹腔注射或 50 mg/kg-200 mg/kg 通过口服处理) 处理携带 HT-29, A549, 和 SB-CL2 细胞的小鼠移植瘤模型, 抑制肿瘤生长。MP-470 (20 mg/kg) 和 Erlotinib 联用处理携带 LNCaP 移植瘤的小鼠, 显著抑制肿瘤生长。		

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)

MB3947	CP-673451
MB5074	利尼伐尼; ABT869
MB3995	Telatinib

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。Amuvatinib (MP-470) 是多靶点抑制剂, 作用于 c-Kit(D816H), PDGFR α (V561D) 和 FLT3(D835Y)。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	2.2346 mL	11.1729 mL	22.3459 mL
5 mM	0.4469 mL	2.2346 mL	4.4692 mL
10 mM	0.2235 mL	1.1173 mL	2.2346 mL
50 mM	0.0447 mL	0.2235 mL	0.4469 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>c-Kit 和 PDGFRα激酶抑制实验:</p> <p>为了测定对 c-Kit 和 PDGFRα的抑制活性,酶与不同浓度 MP-470 温育, 然后使用γ-32P-ATP 进行放射性标记。30 分钟后, 反应混合物在聚丙烯酰胺凝胶上进行电泳和自磷酸化, 测量渗透进酶的放射量。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: MiaPaCa-2, PANC-1, 和 GIST882 细胞</p> <p>Concentrations: 0-30 μM, 溶于 DMSO</p> <p>Incubation Time: 96 小时</p> <p>Method: 细胞按每孔 2×10^3 到 1×10^4 个细胞接种在含 100 μL 培养基的 96 孔 Falcon 板上。第 1 天,加入 10 μL 连续稀释的 MP-470, 一式四份。温育 4 天后, 细胞与 10%三氯乙酸溶液混合。随后,使用溶于 1%乙酸的 0.04% Sulforhodamine B (SRB) 进行标记。多次冲洗, 除去多余染料, 每孔加入 100 μL 50 mM Tris 溶液, 溶解染料。然后在酶标仪上在 570 nm 处测定每孔的吸光值。通过吸光值, 计算与对照组相比的存活百分数。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 HT-29, A549,和 SB-CL2 细胞的小鼠(无胸腺裸鼠)移植瘤模型</p> <p>Formulation: 溶于玉米油, 用于口服; 溶于 TV-10 (60% 丙二醇, 30% PEG300, 10% 水,和 150 mg/mL 2-羟丙基-β-环糊精)或 TV-10 (5% 乙醇, 40% 甘油, 55% 水, 和 300 mg/mL 环糊精)用于腹腔注射</p> <p>Dosages: 10 mg/kg-75 mg/kg (腹腔注射)或 50 mg/kg-200 mg/kg (口服处理)</p> <p>Administration: 口服饲喂或腹腔注射</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。

