

## BMS-777607

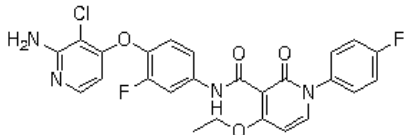
产品编号：MB3951

质量标准：>98%，Met 相关的抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C25H19ClF2N4O4	结 构 式	
分子量	512.89		
CAS No.	1025720-94-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 47 mg/mL (91.63 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：**BMS 777607 是一种 Met-related 抑制剂，能够抑制 c-Met，Axl，Ron 和 Tyro3 的活性。

**别名：**BMS 817378；3-Pyridinecarboxamide, N-[4-[(2-amino-3-chloro-4-pyridinyl)oxy]-3-fluorophenyl]-4-ethoxy-1-(4-fluorophenyl)-1,2-dihydro-2-oxo

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 47 mg/mL (91.63 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>	BMS-777607 是 Met 相关的抑制剂，作用于 c-Met, Axl, Ron 和 Tyro3 时，IC50 分别为 3.9 nM, 1.1 nM, 1.8 nM 和 4.3 nM, 作用于 Met 相关靶点比作用于 Lck, VEGFR-2, 和 TrkA/B 选择性高 40 倍, 比作用于其他受体和非受体激酶选择性高 500 多倍。				
<b>靶点</b>	Met	Axl	Ron	Tyro3	Mer
<b>IC50</b>	3.9 nM	1.1 nM	1.8 nM	4.3 nM	14 nM

<b>体外研究</b>	BMS-777607 是 ATP 竞争性 Met 激酶选择性抑制剂, 有效抑制 c-Met 自磷酸化, 作用于 GTL-16 细胞裂解物, IC <sub>50</sub> 为 20 nM, 且选择性抑制 Met 驱动的肿瘤细胞系如 GTL-16 细胞系, H1993 和 U87 增殖。BMS-777607 作用于 DU145 前列腺癌细胞, 抑制肝细胞生长因子 (HGF) 引起的 c-Met 自磷酸化, IC <sub>50</sub> < 1 nM。BMS 777607 对肿瘤细胞生长作用效果不大, 但是作用于 PC-3 和 DU145 细胞, 抑制 HGF 诱导的细胞分散。BMS 777607 作用于这两种细胞, 也抑制刺激的细胞迁移和入侵, IC <sub>50</sub> < 0.1 μM, 这种作用存在剂量依赖性。BMS 777607 (~10 μM) 作用于高度转移性鼠科 KHT 细胞 2 小时, 有效清除自磷酸化的 c-Met 水平, IC <sub>50</sub> 为 10 nM, 不影响全部 c-Met, 导致下游信号分子包括 ERK, Akt, p70S6K 和 S6 受抑制, 这种作用存在剂量依赖性。纳摩尔级 BMS-777607 (~1 μM) 处理 24 小时, 有效抑制 KHT 细胞分散, 活动, 和入侵, 这与 MET 基因抑制相关, 适当影响细胞增殖和集落形成。
<b>体内研究</b>	BMS 777607 按 6.25-50 mg/kg 剂量口服处理给药携带 GTL-16 人类移植瘤的无胸腺小鼠, 明显降低肿瘤体积, 且没有毒性。BMS 777607 按 25 mg/kg 剂量每天处理 6-8 周大的注射啮齿类纤维肉瘤 KHT 细胞的雌性 C3H/HeJ 小鼠, 降低 KHT 肺肿瘤结节数量, 提高形态出血, 且明显修复损害转移表型, 与对照组相比, 没有明显毒性。BMS 777607 按 10 mg/kg 低剂量处理, 也适度但不显著抑制肺结节形成。
<b>特征</b>	BMS 777607 是有效的 Met 家族成员抑制剂, 比作用于 Lck, VEGFR-2, 和 TrkA/B 的选择性高 40 多倍, 比作用同样其他受体和非受体激酶选择性高 500 多倍。

### 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)

MB5240	<a href="#">JNJ38877605</a>
MB3950	<a href="#">MK-2461</a>
MB8803	<a href="#">PHA-665752</a>
MB9673	<a href="#">Tivantinib (ARQ 197)</a>

**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。BMS 777607 是一种 Met-related 抑制剂, 能够抑制 c-Met, Axl, Ron 和 Tyro3 的活性。本品可用于相关领域的科研实验。

### 储液配置

体 积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9497 mL	9.7487 mL	19.4974 mL
5 mM	0.3899 mL	1.9497 mL	3.8995 mL
10 mM	0.1950 mL	0.9749 mL	1.9497 mL

50 mM	0.0390 mL	0.1950 mL	0.3899 mL
-------	-----------	-----------	-----------

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>Met Kinase 检测:</b>                      激酶反应由表达 GST-Met 的杆状病毒, 3<math>\mu</math>g 聚 (Glu / Tyr), 0.12<math>\mu</math>Ci<sup>33</sup>P<math>\gamma</math>-ATP, 30<math>\mu</math>L 激酶缓冲液中的 1<math>\mu</math>M ATP (20 mM Tris-Cl, 5 mM MnCl<sub>2</sub>, 0.1 mg) 组成 / mL BSA, 0.5mM DTT)。将反应在 30°C 温育 1 小时, 并通过加入冷的三氯乙酸 (TCA) 终止至终浓度为 8%。使用 Filtermate 通用收集器将 TCA 沉淀物收集到 GF / C unifilter 板上, 并使用 TopCount 96 孔液体闪烁计数器对过滤器进行定量。产生剂量响应曲线以确定抑制 50% 底物磷酸化所需的浓度 (IC 50)。将 BMS 777607 以 10mM 溶于二甲基亚砷 (DMSO) 中, 并以 10 个浓度评估, 一式两份。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 啮齿类纤维肉瘤 KHT 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 溶于 DMSO, 作为储存液(10 mM), 终浓度为 10 <math>\mu</math>M 左右</p> <p><b>Incubation Time:</b> 2, 24 和 96 小时</p> <p><b>Method:</b> 用连续稀释的 BMS 777607 处理 KHT 细胞 96 小时, 然后进行 MTT 实验和台酚蓝排除, 分别测定细胞增殖和细胞死亡。KHT 细胞集落和 BMS 777607 温育 24 小时, 然后用结晶紫(0.1%)染色, 然后显影, 测定细胞分散情况。使用无菌的 1 ml 吸管端在融合的 KHT 单层细胞上划 2 mm 痕, 随后用 BMS-777607 处理 24 小时, 在 4 块随机区域中计数迁移到剥蚀地细胞数, 用于测定细胞迁移情况。为了测定细胞入侵, 用 Matrigel 预包装的转移嵌入板(8 <math>\mu</math>m 孔膜), 和无血清培养基在有或无 BMS 777607 存在时, 在 37°C 下温育 2 小时, 使 Matrigel 再水化。悬浮在无血清培养基上的细胞装到小室顶端, 悬浮在含 10% FBS 的完全培养基上的细胞装到小室底端, 作为化学引诱物。温育 24 小时, 移除 Matrigel, 用结晶紫染色。显影并计数在滤液下面的入侵细胞。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 携带啮齿类纤维肉瘤 KHT 细胞的雌性 C3H/HeJ 小鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 溶于 DMSO, 作为储存液(10 mM)</p> <p><b>Dosages:</b> 10-25 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 饲喂处理, 每天一次</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装, 因为分装环境、包装材料等因素可能导致分装后的产品变质; 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。