

**Mubritinib ; TAK 165**

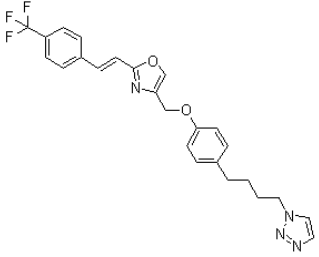
产品编号 : MB3954

质量标准 : &gt;98% , 有效的 HER2/ErbB2 抑制剂

包装规格 : 10MG;25MG;200MG

产品形式 : solid

**基本信息**

分子式	C <sub>25</sub> H <sub>23</sub> F <sub>3</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>	结 构 式	
分子量	468.47		
CAS No.	366017-09-6		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 13 mg/mL (27.74 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 :** 木利替尼 Mubritinib (TAK-165) 是有效, 选择性的 EGFR2/HER2 抑制剂。**别名 :** TAK-165 ; Mubritinib ; 木利替尼 ; 1H-1,2,3-Triazole, 1-[4-[4-[[2-[(1E)-2-[4-(trifluoromethyl)phenyl]ethenyl]-4-oxazolyl]methoxy]phenyl]butyl]-**物理性状及指标 :**

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 13 mg/mL (27.74 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....&gt;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>	Mubritinib (TAK 165)是有效的 HER2/ErbB2 抑制剂, IC <sub>50</sub> 为 6 nM;对 EGFR, FGFR, PDGFR, JAK1, Src 和 Blk 没有抑制作用。
<b>靶点</b>	HER2/ErbB2 (BT-474 cells)
<b>IC<sub>50</sub></b>	6.0 nM

<b>体外研究</b>	Mubritinib 有效抑制人表皮生长因子受体 2(HER2/erbB2), IC50 为 6 nM,比作用于其他酪氨酸激酶, 如 EGFR, FGFR, PDGFR, Jak1, Src 和 Blk 时, 选择性高 4000 多倍。Mubritinib 浓度低至 0.1 μM 时, 作用于携带高水平 HER2 的细胞系 BT474 时, 也显著抑制 HER2 磷酸化,导致 PI3K-Akt 和 MAPK 通路的下调。Mubritinib 不仅作用于过表达 ErbB2 的肿瘤细胞系 BT474 时, 具有高效抗增殖效果, IC50 为 5 nM, 而且作用于每周表达 HER2 的细胞系, 也具有显著的抗增殖效果, 作用于 LNCaP, LN-REC4 和 T24 细胞时, IC50 分别为 53 nM, 90 nM 和 91 nM。Mubritinib 作用于非常微弱表达 HER2 的 PC-3 细胞时, 没有抑制活性, IC50 为 4.62 μM,作用于过表达 EGFR 的 HT1376 和 ACHN 细胞系时, 也无抑制活性, IC50>25 μM。
<b>体内研究</b>	Mubritinib 显著抑制 LN-REC4 移植瘤, 实验组/对照组肿瘤体积比为 26.5%。虽然在体外 Mubritinib 对 UMUC-3 和 ACHN 细胞抑制无效 (IC50s 分别为 1.812 和 >25 μM),但是 Mubritinib 按 10 或 20 mg/kg 剂量每天口服给药处理, 则显著抑制 UMUC-3 和 ACHN 移植瘤生长, 实验组/对照组肿瘤体积比分别为 22.9%和 26%, 而 Herceptin 按 20 mg/kg 剂量处理 UMUC-3 肿瘤, 对肿瘤生长没有作用效果。

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)

MB3946	BMS-794833
MB2026	BMS582664
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。木利替尼 Mubritinib (TAK-165) 是有效, 选择性的 EGFR2/HER2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1346 mL	10.6730 mL	21.3461 mL
5 mM	0.4269 mL	2.1346 mL	4.2692 mL
10 mM	0.2135 mL	1.0673 mL	2.1346 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<b>HER2/erbB2 酪氨酸激酶活性抑制实验:</b> BT-474 细胞接种在 24 孔板上, 过夜培养。加入不同浓度 Mubritinib。温育 2 小时后, 收集细胞, 直接加到 SDS 样本缓冲液 (200 μL) 中。含等量全部细胞抽提物的等分样在 7.5%到 15%梯度 SDS-PAGE 上跑电泳。之后, 蛋白转移到 PVDF 膜上, 使用相关的一抗进行 western blot 分
-------------	---

	析。通过增强化学发光 (ECL) 检测方法完成蛋白检测。通过 LAS-1000 及 lumino-图像分析仪测量 HER2/erbB2 酪氨酸磷酸化的程度。通过反应的最小二乘线性回归, 使用 SAS 软件, 获得剂量-反应曲线, 然后根据剂量-反应曲线计算抑制 HER2/erbB2 磷酸化程度为 50% (IC50) 时的 Mubritinib 浓度。
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> BT474, HT1376, UMUC-3, T24, ACHN, DU-145, PC-3, LN-REC4, 和 LNCaP 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 溶于 DMSO, 终浓度为~50 mM</p> <p><b>Incubation Time:</b> 72 小时</p> <p><b>Method:</b> 细胞接种在 6 孔板上, 培养过夜。然后加入不同浓度 Mubritinib, 持续处理细胞 72 小时。温育期结束后, 计数细胞数, 测量抗增殖活性。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 皮下移植 UMUC-3, LN-REC4 或 ACHN 细胞的无胸腺裸鼠(BALB/c nu/nu)和 SCID 小鼠 (C.B.-17 Scid/Scid)</p> <p><b>Formulation:</b> 溶于 DMSO, 用盐水稀释</p> <p><b>Dosages:</b> 10 或 20 mg/kg/day</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理, 每天两次</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。