TAE226；NVP-TAE226

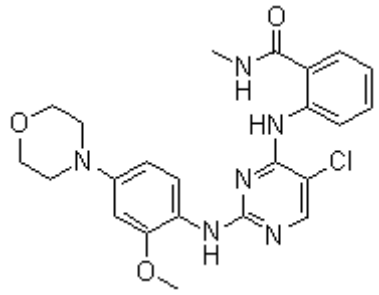
产品编号：MB3965

质量标准：>98%，FAK 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C23H25ClN6O3	结构式	
分子量	468.94		
CAS No.	761437-28-9		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：94 mg/mL (200.45 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：NVP-TAE 226 是一种双重酪氨酸激酶抑制剂，作用于 FAK 和 IGF-IR。

别名：TAE226；Benzamide, 2-[[5-chloro-2-[[2-methoxy-4-(4-morpholinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]amino]-Nmethyl

物理性状及指标：

外观：.....白色至卡其色固体

溶解性：.....DMSO：94 mg/mL (200.45 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	TAE226 (NVP-TAE226)是一种有效的 FAK 抑制剂，IC50 为 5.5 nM，最有效作用于 Pyk2，对 InsR， IGF-1R， ALK 和 c-Met 作用效果比其弱 10 到 100 倍左右。				
靶点	PYK2 (cell-free assay)	FAK (cell-free assay)	Insulin Receptor (cell-free assay)	IGF-1R (cell-free assay)	c-Met (cell-free assay)
	3.5 nM	5.5 nM	43.5 nM	140 nM	160 nM

体外研究	在血清饥饿的 U87 细胞中，NVP-TAE226(< 1 μM)抑制细胞外基质诱导的 FAK(Tyr397)自身磷酸化。U87 和 U251 细胞中，NVP-TAE226 (< 1 μM)也会抑制 IGF-I-诱导的 IGF-1R 磷酸化和其下游靶点基因，比如 MAPK 和 Akt 的活性。U87 和 U251 细胞中，NVP-TAE226 (<10 μM)阻碍肿瘤细胞生长，并减弱 G(2)-M 细胞周期进程，其与细胞周期素 B1 和磷酸化 cdc2 (Tyr15)蛋白质表达的减少相关。在体外胶质瘤细胞系人工基底膜侵袭实验中，与对照组相比，NVP-TAE226 (1 μM)抑制至少 50%的肿瘤细胞侵袭。根据 caspase-3/7 活化和 poly(ADP-ribose)聚合酶裂解以及膜联蛋白 V 凋亡试验，NVP-TAE226 (1 μM)治疗对胶质瘤细胞系，包括野生型 p53，仅表现出 G(2)-M 期阻滞，而负荷突变体 p53 的胶质瘤细胞会发生细胞凋亡。在人成神经细胞瘤细胞系 SK-N-AS 中，NVP-TAE226 (5 μM)抑制 FAK 磷酸化。NVP-TAE226 (<10 μM)对人成神经细胞瘤细胞系 SK-N-AS 的治疗导致细胞活性降低，细胞周期阻滞，以及细胞凋亡增加。NVP-TAE226 (0.1 μM-10 μM)抑制 HMEC1 细胞的微管形成。
体内研究	NVP-TAE226(75 mg/kg)显著增加负荷颅内胶质瘤异种移植物的小鼠的存活率。在人结肠癌 SCID 小鼠模型中，NVP-TAE226 (100 mg/kg，口服)显著降低微血管密度。在体内模型中，NVP-TAE226 (100 mg/kg，口服)有效抑制 MIA PaCa-2 人胰腺肿瘤生长，而不引起体重损失。 在体内模型中，NVP-TAE226 剂量依赖性抑制 4T1 小鼠乳腺瘤生长和肺转移，与 Y397 上 FAK 的自身磷酸化和丝氨酸 473 上 Akt 磷酸化的抑制相关。

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)

MB3966	PF-00562271
MB2682	PF-562271
MB3968	PF-573228

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。NVP-TAE 226 是一种双重酪氨酸激酶抑制剂，作用于 FAK 和 IGF-IR。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 浓度 / 质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1325 mL	10.6623 mL	21.3247 mL
5 mM	0.4265 mL	2.1325 mL	4.2649 mL
10 mM	0.2132 mL	1.0662 mL	2.1325 mL
50 mM	0.0426 mL	0.2132 mL	0.4265 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	**Cell lines:** U87 和 U251 细胞系 **Concentrations:** 10 μM **Incubation Time:** 5 天

	Method: 细胞培养物用 0.05%胰蛋白酶采集，并重复三份以 2 × 104 接种在 24 孔培养板，24 小时后用药物处理。培养基用于模拟处理。处理后，在指定当天采集细胞，活细胞使用 Vi-细胞活性分析计数。
动物实验	**Animal Models:** 负荷颅内胶质瘤异种移植物的雄性裸鼠 **Formulation:** 0.5% 甲基纤维素 **Dosages:** 75 mg/kg **Administration:** 通过口服给药

【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。