

## PF-00562271

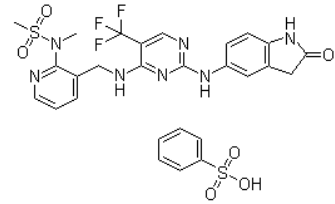
产品编号：MB3966

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	C <sub>21</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>7</sub> O <sub>3</sub> S.C <sub>6</sub> H <sub>6</sub> O <sub>3</sub> S	结 构 式	
分子量	665.66		
CAS No.	939791-38-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 14 mg/mL warmed (21.03 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：**PF-562271 besylate 是一种有效的，ATP 竞争性的，可逆的 FAK 和 Pyk2 kinase 抑制剂，对其活性是对 CDK 酶以外的其他酶的 100 多倍。

**别名：**PF562271 besylate; PF 562271 besylate ; Methanesulfonamide, N-[3-[[[2-[(2,3-dihydro-2-oxo-1H-indol-5-yl)amino]-5-(trifluoromethyl)-4-pyrimidinyl]amino]methyl]-2-pyridinyl]-N-methyl-, benzenesulfonate (1:1)

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 14 mg/mL warmed (21.03 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>	PF-00562271 是 PF-562271 的苯磺酸盐，是一种有效的，ATP 竞争性，可逆的 FAK 抑制剂，IC <sub>50</sub> 为 1.5 nM，作用于 Pyk2 比作用于 FAK 效果低 10 倍左右，比作用于其他蛋白激酶（除了一些 CDKs）选择性高 100 倍以上。				
<b>靶点</b>	FAK	PYK2	CDK2/CyclinE	CDK3/CyclinE	CDK1/CyclinB

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	1.5 nM	13 nM	30 nM	47 nM	58 nM
<b>体外研究</b>	在重组酶实验中, PF-562271 选择性抑制 FAK 和 Pyk2 酪氨酸激酶活性, IC50 分别为 1.5 nM 和 14 nM。在细胞实验中, PF-562271 作用于 FAK 的 IC50 值为 5 nM, 比作用于其他激酶靶点选择性更高。在二维培养中, PF-562271 抑制 FAK WT,FAK-/- 和 FAK 激酶缺乏(KD)的细胞增殖, IC50 分别为 3.3 μM, 2.08 μM 和 2.01 μM。				
<b>体内研究</b>	PF-562271 作用于一些人类皮下移植瘤模型, 抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 且产生最大肿瘤抑制效果, 按 25 到 50 mg/kg 剂量作用于 PC-3M, BT474, BxPc3, 和 LoVo 细胞, 每天两次, 抑制达 78%到 94%, 没有发生体重降低, 生病或死亡。[1]PF-562271 按 25 mg/kg 剂量口服处理皮下和骨转移 PC3M-LUC-5233 移植瘤模型, 显著降低肿瘤进展。				

### 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)

MB2682	PF-562271
MB3968	PF-573228
MB3965	TAE226 (NVP-TAE226)

**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。PF-562271 besylate 是一种有效的, ATP 竞争性的, 可逆的 FAK 和 Pyk2 kinase 抑制剂, 对其活性是对 CDK 酶以外的其他酶的 100 多倍。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	1.5023 mL	7.5113 mL	15.0227 mL
5 mM	0.3005 mL	1.5023 mL	3.0045 mL
10 mM	0.1502 mL	0.7511 mL	1.5023 mL
50 mM	-	-	-

### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<b>重组激酶实验和酶动力学:</b> 纯化激活的 FAK 激酶域 (第 410-689 位氨基酸) 与 50 μM ATP, 和每孔 10 μg Glu 和 Tyr, p(Glu/Tyr)随机肽聚合物, 在激酶 buffer [50 mM HEPES (pH 7.5), 125 mM NaCl, 和 48 mM MgCl <sub>2</sub> ] 中反应 15 分钟。使用从 1 μM 连续稀释的 PF-562271 进行 p(Glu/Tyr)磷酸化。实验中
-------------	--

	<p>每种实验浓度重复三次。使用通用 抗磷酸酪氨酸 (PY20) 抗体和随后的辣根过氧化物酶 ( HRP ) 标记的羊抗鼠 IgG 抗体检测 p(Glu/Tyr) 的磷酸化。加入 HRP 底物, 加入终止液(2 M H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>), 在 450 nm 处测定吸光值。使用 Hill-Slope 模型测定 IC50 值。使用 KinaseProfiler 选择性筛选服务系统通过 UpState 生物技术进行广谱激酶选择谱研究。</p>
细胞实验	<p><b>Cell lines:</b> 鳞状细胞癌(SCC)  <b>Concentrations:</b> 0 到 1 μM  <b>Incubation Time:</b> 72 小时  <b>Method:</b> 细胞接种 48 小时后, 加入 PF-562271。加入冰冻 25% 三氯乙酸 (TCA) 溶液, 混合细胞, 3 天后, 使用 Sulforhodamine B(SRB) 染料染色。使用 1% 冰醋酸冲洗实验板, 烘干, 然后再悬浮在 10 mM Tris buffer, pH 10.5 中, 然后在 540 nm 处测定吸光值。拟合曲线, 使用 GraphPad Prism 4 软件从 6 次重复测定中获得 IC50 值。</p>
动物实验	<p><b>Animal Models:</b> PC-3M, BT474, BxPc3, LoVo, U87MG, H125 和 H460 细胞皮下注射到无胸腺雌性小鼠右侧  <b>Formulation:</b> PF-562271 溶于 5% Gelucire  <b>Dosages:</b> ≤100 mg/kg  <b>Administration:</b> 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, 否则会严重影响化合物活性, 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。