

PF573228 ; PF-573228

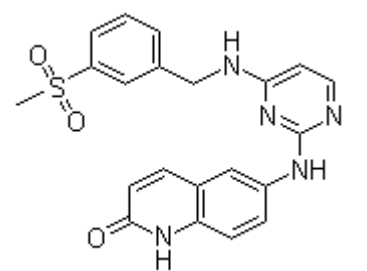
产品编号 : MB3968

质量标准 : >98% , FAK 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H20F3N5O3S	结 构 式	
分子量	491.49		
CAS No.	869288-64-2		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 26 mg/mL (52.9 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-573228 是有效的和选择性的 FAK 抑制剂。

别名 : 2(1H)-Quinolinone, 3,4-dihydro-6-[[4-[[[3-(methylsulfonyl)phenyl]methyl]amino]-5-(trifluoromethyl)-2-pyrimidinyl]amino]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 26 mg/mL (52.9 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	PF 573228 是 ATP 竞争性 FAK 抑制剂, IC50 为 4 nM,作用于 FAK 比作用于 Pyk2, CDK1/7 和 GSK-3β选择性高~50 到 250 倍。
靶点	FAK
IC50	4 nM
体外研究	PF 573228 作用于 REF52 细胞, PC3 细胞, SKOV-3 细胞, 及 L3.6p1 和 F-G, MDCK 细

	胞, 抑制 FAK Tyr ³⁹⁷ 磷酸化, IC ₅₀ 为 30-500 nM。然而, PF 573228 (1 μM) 抑制 80% FAK 磷酸化, 却不抑制细胞生长或凋亡。PF 573228 处理细胞, 抑制血清或 FN-定向迁移, 且降低粘着斑转换。
体内研究	在 Ctrl-MT 小鼠中, 通过 PF-573228 抑制 FAK 能显著地抑制乳腺肿瘤的发生以及肺癌的转移。相反地, 用 PF-573228 处理 MFCKO-MT 小鼠则不影响乳腺肿瘤的发生, 这可能与这些小鼠中乳腺上皮细胞缺失 FAK 有关。

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)

MB3324	Defactinib
MB3966	PF-00562271
MB2682	PF-562271

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-573228 是有效的和选择性的 FAK 抑制剂。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	2.0346 mL	10.1731 mL	20.3463 mL
5 mM	0.4069 mL	2.0346 mL	4.0693 mL
10 mM	0.2035 mL	1.0173 mL	2.0346 mL
50 mM	0.0407 mL	0.2035 mL	0.4069 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>亲和测定: 纯化的激活 FAK 激酶结构域 (410-689 氨基酸) 与 50 μM ATP, 和每孔 10 μg Glu 和 Tyr 的随机肽 (摩尔比为 4:1), 聚(Glu/Tyr) 在激酶缓冲液(50 mM HEPES, pH 7.5, 125 mM NaCl, 48 mM MgCl₂) 中反应 15 分钟。使用按 1/2-Log 浓度连续稀释的化合物 (起始于 1 μM 的最高浓度) 处理磷酸化的聚(Glu/Tyr)。每种浓度按一式三份进行。使用一般的抗磷酸化酪氨酸 (PY20) 抗体, 随后使用辣根过氧化物酶偶联的山羊抗小鼠 IgG 抗体检测聚(Glu/Tyr)的磷酸化。加入标准的辣根过氧化物酶底物 3,3</p>
细胞实验	<p>Cell lines: REF52 或 PC3 细胞 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 3 天</p>

	Method: REF52 或 PC3 细胞按每孔 1×10^4 接种在 24 孔板中，一式三份，24 小时后，使用指定浓度的每种抑制剂处理，进行生长实验，持续 3 天。随后，收集细胞并计数。
动物实验	Animal Models: Ctrl-MT 和 MFCKO-MT 小鼠 Formulation: -- Dosages: 5 mg/kg Administration: 口服

【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(M ²)	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。