

## OSI-930

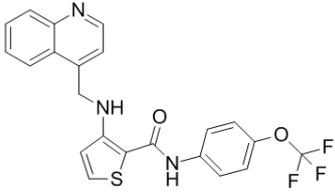
产品编号：MB3993

质量标准：>98%, Kit, KDR 和 CSF-1R 抑制剂

包装规格：5MG;10MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C22H16F3N3O2S	结 构 式	
分子量	443.44		
CAS No.	728033-96-3		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 89 mg/mL (200.7 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 3 mg/mL (6.76 mM)		
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：**OSI-930 是 Kit, KDR 和 CSF-1R 的抑制剂，对 Flt-1, c-Raf 和 Lck 有接近的抑制性，但对 PDGFR $\alpha/\beta$ , Flt-3 和 Abl 抑制性较弱。

**别名：**2-Thiophenecarboxamide, 3-[(4-quinolinylmethyl)amino]-N-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]-

### 物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 89 mg/mL (200.7 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 3 mg/mL (6.76 mM)

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>	OSI-930 是有效的 Kit, KDR 和 CSF-1R 抑制剂，IC50 分别为 80 nM, 9 nM 和 15 nM, 对 Flt-1, c-Raf 和 Lck 具有适度的抑制活性，对 PDGFR $\alpha/\beta$ , Flt-3 和 Abl 抑制活性较低。					
<b>靶点</b>	FLT1 (Cell-free assay)	KDR (Cell-free assay)	CSF-1R (Cell-free assay)	LCK (Cell-free assay)	C-Raf (Cell-free assay)	FLT1 (Cell-free assay)
<b>IC50</b>	8 nM	9 nM	15 nM	22 nM	41 nM	8 nM
<b>体外研究</b>	在体外，OSI-930 有效抑制重组受体酪氨酸激酶活性，作用于 Kit, KDR, Flt, CSF-1R, c-Raf 和 Lck 时，IC50 分别为 80 nM, 9 nM, 8 nM, 15 nM, 41 nM 和 22 nM。OSI-930 作用于 HMC-1 细胞系，抑制细胞增殖，IC50 为 14 nM，而作用于不表达组成型激活的突变受体酪氨酸激酶的 COLO-205 细胞，不会显著抑制生长。而且，OSI-930 也诱导 HMC-1 细胞凋亡，EC50 为 34 nM。最新研究显示 OSI-930 使纯化重组细胞色素 P450 (P450) 3A4 失活，K <sub>i</sub> 为 24 $\mu$ M，这种作用存在时间和浓度依赖性。					

<b>体内研究</b>	OSI-930 按最大有效剂量 200 mg/kg 口服饲喂处理给药多种临床前期移植瘤模型。包括 HMC-1, NCI-SNU-5, COLO-205 和 U251 移植瘤模型，具有有效的抗肿瘤活性。
-------------	--

**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)**

MB3995	Telatinib
MB3934	Semaxanib(SU-5416)
MB3997	ZM306416

**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。OSI-930 是 Kit, KDR 和 CSF-1R 的抑制剂，对 Flt-1, c-Raf 和 Lck 有接近的抑制性，但对 PDGFR $\alpha/\beta$ , Flt-3 和 Abl 抑制性较弱。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	2.2551 mL	11.2755 mL	22.5510 mL
5 mM	0.4510 mL	2.2551 mL	4.5102 mL
10 mM	0.2255 mL	1.1275 mL	2.2551 mL
50 mM	0.0451 mL	0.2255 mL	0.4510 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>蛋白激酶实验:</b> 使用 ELISA 实验法(Kit, KDR, PDGFR<math>\alpha</math>, 和 PDGFR<math>\beta</math>)或辐射测量法进行蛋白激酶实验。ELISA 法使用聚 (Glu:Tyr) 作为底物，结合到 96 孔板表面，然后使用抗磷酸酪氨酸抗体结合 HRP 测定磷酸化。使用 ABTS 作为过氧化物酶底物，通过在 405/490 nm 处测定吸光值，而测量结合的抗体。所有实验使用昆虫细胞或细菌表达的纯化重组激酶催化区。实验中使用的 Kit 和 EGFR 蛋白是内部制备的，其他酶(PDGFR<math>\alpha</math>, PDGFR<math>\beta</math>和 KDR)是购买的。在昆虫细胞中，重组 Kit 蛋白表达作为 NH2 末端-谷胱甘肽 S 转移酶融合蛋白，最初纯化为非磷酸化(非激活) 酶，具有较高 ATP (400 <math>\mu</math>M) 的 <math>K_m</math> 值。在一些实验中通过与 1 mM ATP 在 30°C 下温育 1 小时，而制备酶的活性形式 (酪氨酸磷酸化的)。磷酸化蛋白通过脱盐柱，除去大部分 ATP，然后储存在含 50% 甘油的 buffer 中，储存 -80°C 下。由此产生的制备液比初始非磷酸化的制备液具有相对较高的特定活性，而 ATP (25 <math>\mu</math>mol/L) 的 <math>K_m</math> 值较低。在 200 <math>\mu</math>M ATP 和不同浓度 OSI-930 存在时，非磷酸化的酶在 30°C 下温育，然后测量 OSI-930 抑制 Kit 自磷酸化的情况。移除等样到 SDS-PAGE 样本缓冲液中，然后在 100°C 下加热 5 分钟，终止反应。通过对全部 Kit 和磷酸化的 Kit 进行免疫印迹，而测定 Kit 磷酸化程度。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> HMC-1 和 COLO-205 <b>Concentrations:</b> 0 到 1 <math>\mu</math>M <b>Incubation Time:</b> 48 小时 <b>Method:</b> 细胞增殖和凋亡实验中，细胞接种在 96 孔板中，然后在不同浓度 OSI-930 存在时，温育 2 到 3 天。使用 CellTiterGlo 荧光定量测量细胞内 ATP 含量，而测定抑制细胞生长的情况。通过酶 caspase 3/7 实验定量测量 OSI-930 诱导 caspase 依赖性凋亡的情况。使用大鼠主动脉环内皮生长实验监测 OSI-930 抑制血管生成的情况。从 CO<sub>2</sub>-安乐死雄性大鼠获得部分主动脉，然后体外培养在胶原蛋白基质中。1 型大鼠尾胶原溶于 0.1% 乙酸 3 mg/mL，与 0.125</p>

	<p>体积胶原(0.05 N NaOH, 200 mM HEPES, 260 mM NaHCO<sub>3</sub>), 0.125 体积培养基 199, 0.0125 体积 1 mol/L NaOH, 和 1% GlutaMax 混合, 在上述混合液中制备胶原蛋白基质。主动脉环嵌入含 0.4 mL 胶原蛋白基质的 6 孔板中, 0.5 mL 内皮细胞基本培养基和适量 OSI-930 加到 6 孔板中, 主动脉环温育 10 天, 通过在主动脉组织区域周围一系列同心圆内测定生长区, 然后通过图像数字化测量血管生长。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> HMC-1, NCI-SNU-5, COLO-205 和 U251 细胞皮下注射到 CD1 nu/nu 小鼠</p> <p><b>Formulation:</b> OSI-930 溶于 Labrafil M 1944 CS 或 PEG-400/水 (50:50)</p> <p><b>Dosages:</b> ≤200 mg/kg</p> <p><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 <sup>2</sup> )	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。

干燥器中保存。