

MGCD265 ; MGCD-265

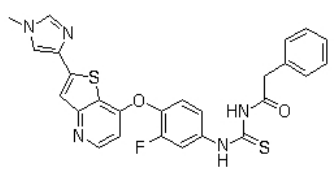
产品编号 : MB3994

质量标准 : >98% , VEGFR1/2/3 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C26H20FN5O2S2	结 构 式	
分子量	517.60		
CAS No.	875337-44-3		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 104 mg/mL (200.92 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 : MGCD-265 是有效的, 多靶点, 及 ATP 竞争性的 c-Met 和 VEGFR1/2/3 抑制剂。

别名 : Benzeneacetamide, N-[[[3-fluoro-4-[[2-(1-methyl-1H-imidazol-4-yl)thieno[3,2-b]pyridin-7-yl]oxy]phenyl]amino]thioxomethyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 104 mg/mL (200.92 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	MGCD-265 是有效的, 多靶点, 及 ATP 竞争性的 c-Met 和 VEGFR1/2/3 抑制剂, IC50 分别为 1 nM, 3 nM/3 nM/4 nM, 也抑制 Ron 和 Tie2。				
靶点	Met	RON	VEGFR1	VEGFR2	VEGFR3
IC50	1 nM	2 nM	3 nM	3 nM	4 nM
体外研究	MGCD-265 是多靶点受体酪氨酸激酶抑制剂。MGCD-265 有效抑制 Met, MetY1235D, MetM1250T, VEGFR1, VEGF2, VEGF3, Ron, 和 Tie2, IC50 为 1 nM 到 7 nM。MGCD-265 作用于 c-Met 驱动的肿瘤细胞 (MKN45, MNNG-HOS, 和 SNU-5) 和非 c-Met-驱动的肿瘤细胞 (HCT116 和 MDA-MB-231), 抑制细胞增殖, IC50 分别为 6 nM-30 nM 和 1 μM-3 μM。40 nM-5 μM MGCD-265 作用于血清饥饿处理的 MKN45 细胞, 有效抑制 c-Met 磷酸化和 c-Met 下游信号通路, 包括 Erk, Akt, Stat3, 和 Fak。6 nM-1 μM MGCD-265 作用于 MKN45 细胞, 也诱导细胞凋亡。				
体内研究	MGCD-265 按 20 mg/kg-60 mg/kg 剂量作用于 c-Met 驱动的或非 c-Met 驱动的携带 MKN45, U87MG, MDA-MB-231, COLO205, 和 A549 移植瘤的小鼠, 抑制肿瘤生长和 c-Met				

	信号通路。MGCD-265 按 40 mg/kg 剂量作用于携带 U87MG 移植瘤小鼠的肿瘤和血浆，也下调与血管生成有关的基因，包括 VEGF 和 IL-8。MGCD-265 也抑制 c-Met 的血药浓度。
特征	MGCD-265 是有效的多靶点 ATP 竞争性的受体酪氨酸激酶抑制剂，包括 Met, VEGFR, Ron, 和 Tie2。

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)

MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3950	MK-2461
MB8803	PHA-665752

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。MGCD-265 是有效的，多靶点，及 ATP 竞争性的 c-Met 和 VEGFR1/2/3 抑制剂，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	1.9320 mL	9.6600 mL	19.3199 mL
5 mM	0.3864 mL	1.9320 mL	3.8640 mL
10 mM	0.1932 mL	0.9660 mL	1.9320 mL
50 mM	0.0386 mL	0.1932 mL	0.3864 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: HCT116, MDA-MB-231, SNU-5, 和 MKN45 细胞</p> <p>Concentrations: 0-5 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method:</p> <p>用 MGCD-265 处理细胞 72 小时，测定细胞数作为线粒体活性的一个功能，随后和 MTT 温育 4 小时。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 MKN45, U87MG, MDA-MB-231, COLO205, 和 A549 细胞的雄性 CD-1 裸鼠移植瘤模型</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 20 mg/kg-60 mg/kg</p> <p>Administration: 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(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。