

## Avagacestat (BMS-708163)

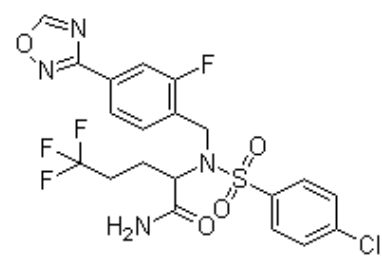
产品编号：MB4123

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C20H17ClF4N4O4S	结 构 式	
分子量	520.88		
CAS No.	1146699-66-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 104 mg/mL (199.66 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：**BMS-708163 是有效的  $\gamma$ -secretase 抑制剂，抑制 A $\beta$ 42 和 A $\beta$ 40 的产生，BMS-708163 同时抑制 Notch 胞内结构域 (NICD) 和 CYP2C19。

**别名：**BMS-708163；Pentanamide, 2-[[[4-chlorophenyl)sulfonyl][[2-fluoro-4-(1,2,4-oxadiazol-3-yl)phenyl)methyl]amino]-5,5,5-trifluoro-, (2R)-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 104 mg/mL (199.66 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	Avagacestat (BMS-708163)是口服生物有效的，选择性的 $\gamma$ -分泌酶抑制剂，作用于 A $\beta$ 40 和 A $\beta$ 42 时，IC50 分别为 0.3 nM 和 0.27 nM，比作用于 Notch 选择性高 193 倍。Phase 2。
特性	BMS-708163 作用于 Notch 过程似乎比 semagacestat (LY450139)效果要好，且所需量少

<b>靶点</b>	$\gamma$ secretase(A $\beta$ 42) (in H4-8Sw cells) 0.27 nM	$\gamma$ secretase(A $\beta$ 40) (in H4-8Sw cells) 0.3 nM
<b>体外研究</b>	BMS-708163 抑制 Notch 过程时显示出低选择性。	
<b>体内研究</b>	鼠和犬口服处理 BMS-708163 明显且长期降低脑，血浆，脑脊液中的 A $\beta$ 40 水平。BMS-708163 作用于犬时，没有剂量限制影响(用 3 mg/kg BMS-708163 处理 6 个月内的犬)。	

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)

MB5152	DAPT (GSI-IX)
MB3697	LY411575
MB3695	MK-0752
MB3696	YO-01027 (Dibenzazepine)

**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。BMS-708163 是有效的  $\gamma$ -secretase 抑制剂，抑制 A $\beta$ 42 和 A $\beta$ 40 的产生，BMS-708163 同时抑制 Notch 胞内结构域 (NICD) 和 CYP2C19。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置：**

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9198 mL	9.5991 mL	19.1983 mL
5 mM	0.3840 mL	1.9198 mL	3.8397 mL
10 mM	0.1920 mL	0.9599 mL	1.9198 mL
50 mM	0.0384 mL	0.1920 mL	0.3840 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 雌性 Harlan Sprague Dawley 鼠或 ATM-405-142K9, 7 到 10 月大的 naïve II 级犬。</p> <p><b>Formulation:</b> 99% PEG-400, 1% Tween-80 (鼠), 或 94% labrafil-1944, 5% 乙醇, 1% Tween-80 (犬)</p> <p><b>Dosages:</b> 10 mg/kg (鼠) 或 2.5 mg/kg (犬)</p>
-------------	--

**Administration:** 每天口服饲喂

**【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。

C