

2,6-Dimethoxybenzoic acid ; (S)-crizotinib

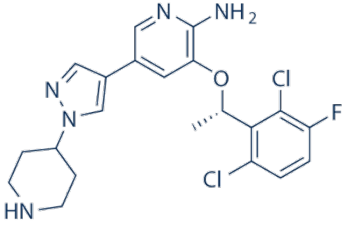
产品编号 : MB4161

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;20MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C21H22Cl2FN5O	结 构 式	
分子量	450.34		
CAS No.	1374356-45-2		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 42 mg/mL warmed (93.26 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 22 mg/mL (48.85 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 : (S)-crizotinib, crizotinib 的(S)型异构体, 是一种有效的 MTH1 (NUDT1)抑制剂。**别名 :**3-[(1S)-1-(2,6-Dichloro-3-fluorophenyl)ethoxy]-5-[1-(4-piperidiny)-1H-pyrazol-4-yl]-2-pyridina
mine**物理性状及指标 :**

外观 :白色至米色固体

溶解性 :DMSO : 42 mg/mL warmed (93.26 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 22
mg/mL (48.85 mM)

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	(S)-crizotinib, crizotinib 的(S)型异构体, 是一种有效的 MTH1 (NUDT1)抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 72 nM。
特性	MTH1 (NUDT1)- selective inhibitor.
靶点	MTH1 (Cell-free assay) 72 nM
体外研究	(S)-crizotinib 通过抑制 MTH1 来破坏核苷酸库的稳态, 诱导 DNA 单链断裂的增加, 激活人结肠癌细胞中 DNA 修复机制。
体内研究	在 SW480 结肠癌模型中, (S)-Crizotinib (50 毫克/千克, 口服, 每天)损害肿瘤的生长。

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)

MB4167	TH588
--------	-----------------------

MB4163

TH287

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。(S)-crizotinib, crizotinib 的(S)型异构体，是一种有效的 MTH1 (NUDT1)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	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2205 mL	11.1027 mL	22.2054 mL
5 mM	0.4441 mL	2.2205 mL	4.4411 mL
10 mM	0.2221 mL	1.1103 mL	2.2205 mL
50 mM	0.0444 mL	0.2221 mL	0.4441 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>MTH1 催化测定:</p> <p>半数最大抑制浓度(IC50)通过稍微改动基于荧光的试验进行测定。简而言之，不断稀释的化合物溶于反应缓冲液中(100 mM 三羟基氨基醋酸盐 pH 7.5, 40 mM NaCl 和包含 0.005% 吐温-20 的 10 mM Mg(OAc)₂ 以及 2 mM 二巯苏糖醇(DTT))。加入终浓度 2 nM 的 MTH1 重组蛋白后，平板在室温条件下摇床摇动 15 分钟。加入底物 dGTP (终浓度 100 μM)，8-oxo-dGTP (终浓度 13.2 μM)，或 2-OH-dATP (终浓度 8.3 μM)，MTH1 对核苷酸三磷酸盐水解作用产生的焦磷酸盐 (PPi)通过 PPi 光无机焦磷酸盐试验试剂盒检测 15 分钟。用 GraphPad Prism 软件通过适当的剂量反应曲线对数据点做非线性回归计算 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: PANC1 和 SW480 细胞</p> <p>Concentrations: ~5 μM</p> <p>Incubation Time: 7-10 天</p> <p>Method:</p> <p>实验前一天，细胞接种于 6 孔板上，培养 24 小时。第二天，加入 DMSO(相当于化合物稀释最大量，最大值为 0.2%)和逐渐增加浓度的化合物，37°C，5% CO₂ 条件下培养 7-10 天。PBS 洗涤细胞后，用冰甲醇固定，结晶紫染色(0.5%的 25% 甲醇溶液)，过夜晾干。对于结果的定量，将结晶紫溶于 70%的乙醇，测定 595nm 的紫外吸收。数据用 GraphPad Prism 软件采用非线性回归分析。</p>
动物实验	<p>Animal Models: SW480 结肠癌异种移植小鼠模型。</p> <p>Formulation: ~50 毫克/千克 每天</p> <p>Dosages: 1% DMSO, 10% 乙醇, 10%克列莫佛, 10% 吐温 80, 69% PBS</p> <p>Administration: 口服</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。

