

Acalabrutinib(ACP-196)

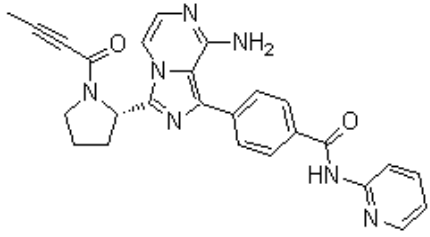
产品编号：MB4286

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₂₃ N ₇ O ₂	结 构 式	
分子量	465.51		
CAS No.	1420477-60-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 93 mg/mL (199.78 mM) Water : Insoluble Ethanol : 93 mg/mL (199.78 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：Acalabrutinib 是一种新颖的，有效的，选择性的 BTK 抑制剂。

别名：ACP-196 ; Benzamide, 4-[8-amino-3-[(2S)-1-(1-oxo-2-butyn-1-yl)-2-pyrrolidinyl]imidazo[1,5-a]pyrazin-1-yl]-N-2- pyridinyl

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 93 mg/mL (199.78 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 93 mg/mL (199.78 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	Acalabrutinib(ACP-196)是选择性的第二代 BTK 抑制剂，抑制 B 细胞表面原抗体信号通路的激活。它具有很好的靶标特异性，对 BTK 的选择性比其他 TEC 激酶家族成员如 ITK、TXK、BMK 和 TEC 的选择性高 323-, 94-, 19-, 9-倍。对 EGFR 没有活性。
靶点	BTK (in a human whole-blood CD69 B cell activation assay) 3nM

体外研究	在初级人源慢性淋巴细胞白血病细胞的体外信号检测中，Acalabrutinib 抑制下游靶标 ERK、IKK、AKT 的酪氨酸磷酸化。在 9 种与 BTK 半胱氨酸所在位置一致的激酶中，Acalabrutinib 对 BTK 的选择性高于对其他激酶。Acalabrutinib 不抑制 EGFR、ITK 和 TEC，对 EGFR 在 Y1068 和 Y1173 位点的磷酸化没有影响。相对于 ibrutinib，Acalabrutinib 具有更高的 IC50 值，并几乎对 ITK, EGFR, ERBB2, ERBB4, JAK3, BLK, FGR, FYN, HCK, LCK, LYN, SRC 以及 YES1 的激酶活性没有抑制作用。
体内研究	对小鼠进行 ACP-196 的口服处理，在 CD19+脾细胞中抑制了 anti-IgM 诱导的 CD86 表达,此抑制作用为剂量依赖性，ED50 为 0.34 mg/kg。在处理 3h，ACP-196 抑制了 >90% 的 CD86 表达水平

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)

MB5288	AVL292
MB5612	依鲁替尼(PCI32765)

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。Acalabrutinib 是一种新颖的，有效的，选择性的 BTK 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	2.1482 mL	10.7409 mL	21.4818 mL
5 mM	0.4296 mL	2.1482 mL	4.2964 mL
10 mM	0.2148 mL	1.0741 mL	2.1482 mL
50 mM	0.0430 mL	0.2148 mL	0.4296 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: 初级人类慢性淋巴细胞白血病细胞，T 细胞，NK 细胞以及上皮细胞</p> <p>Concentrations: --</p> <p>Incubation Time: --</p> <p>Method:</p>
动物实验	<p>Animal Models: 犬类</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 2.5, 5, 10 mg/kg.</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。