

## Brigatinib ; AP26113

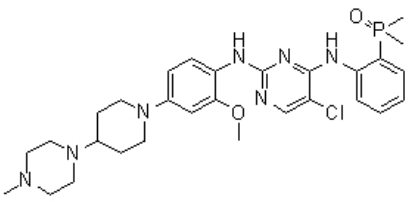
产品编号 : MB4385

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 100MG;500MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C29H39ClN7O2P	结构式	
分子量	584.09		
CAS No.	1197953-54-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 1 mg/mL warmed (1.71 mM) Water : Insoluble Ethanol : 43 mg/mL warmed (73.61 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 :** Brigatinib 是有效, 选择性的 ALK 抑制剂。

**别名 :** 布格替尼 ; AP-26113 ; 2,4-Pyrimidinediamine,

5-chloro-N4-[2-(dimethylphosphinyl)phenyl]-N2-[2-methoxy-4-[4-(4-methyl-1-piperazinyl)-1-piperidinyl]phenyl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 1 mg/mL warmed (1.71 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 43 mg/mL warmed (73.61 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>	Brigatinib (AP26113)是一种有效的、选择性的 ALK 抑制剂, IC50=0.6 nM ; 也是 ROS1 抑制剂, IC50=0.9 nM。它还能以相对较低的效力抑制 FLT3、FLT3(D835Y)、EGFR。								
<b>靶点</b>	<table border="0"> <tr> <td>ALK (Cell-free assay)</td> <td>ROS1say)</td> <td>FLT3 (Cell-free assay)</td> <td>IGF1R (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>0.37 nM</td> <td>1.9 nM</td> <td>2.1 nM</td> <td>24.9 nM</td> </tr> </table> EGFR(C797S/del19) (cell-based) 39.9 nM	ALK (Cell-free assay)	ROS1say)	FLT3 (Cell-free assay)	IGF1R (Cell-free assay)	0.37 nM	1.9 nM	2.1 nM	24.9 nM
ALK (Cell-free assay)	ROS1say)	FLT3 (Cell-free assay)	IGF1R (Cell-free assay)						
0.37 nM	1.9 nM	2.1 nM	24.9 nM						
<b>体外研究</b>	除了 ALK, IGF1R 和 InsR, brigatinib 也能有效地抑制 FLT3 和 ROS1, IC50 分别为 2.1 nM 和 1.9 nM。在 1 μM 时, brigatinib 对 c-Met 或 Ron 没有显著活性。Brigatinib 可克服 EGFR 三突变体的耐药性, 这一活性依赖于 ATP 竞争性, 对野生型 EGFR 的影响较小。								
<b>体内研究</b>	Brigatinib 的口服途径给药在小鼠中的药代动力学 : Cmax=448 ng/mL,t1/2=5.8 h。在 CD 大鼠中, 静脉注射 3 mg/kg 后, CL=0.46 L/(h·kg), t1/2=4.8 h, Vss=7.8 L/kg ; 而口服 10 mg/kg 时, Cmax=305 ng/mL, tmax=4 h, t1/2=3.4 h, F%=52。Brigatinib 具有浓度依赖性的抗肿瘤活性。在 PC9 三突变移植瘤模型中, Brigatinib 具有生长抑制作用, 当其与 anti-EGFR								

抗体一起结合使用时，能在体内外增强功效。

**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)**

MB4538	ASP3026
MB3330	PF-06463922
MB4539	RXDX-101

**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。Brigatinib 是有效，选择性的 ALK 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	1.7121 mL	8.5603 mL	17.1206 mL
5 mM	0.3424 mL	1.7121 mL	3.4241 mL
10 mM	0.1712 mL	0.8560 mL	1.7121 mL
50 mM	0.0342 mL	0.1712 mL	0.3424 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: U937 细胞, Karpas-299 细胞, H3122 细胞            Concentrations: --            Incubation Time: 72 h            Method:            将细胞用抑制剂处理 72 小时，检测细胞生长情况，确定 IC50 值。</p>
<b>动物实验</b>	<p>Animal Models: 雌性 CD 大鼠            Formulation: --            Dosages: 10 mg/kg(p.o); 2 mg/kg(i.v)            Administration: p.o, i.v</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(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。