

PLX3397 ; Pexidartinib (PLX-3397)

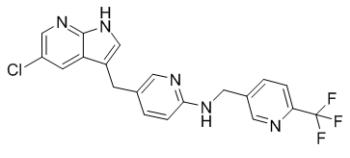
产品编号 : MB4536

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG; 50MG

产品形式 : 白色至卡其色固体

基本信息

分子式	C20H15ClF3N5	结构式	
分子量	417.81		
CAS No.	1029044-16-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 83 mg/mL (198.65 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 : Pexidartinib 是 KIT ,CSF1R 和 FLT3 的抑制剂 ,能够作用于 Fms 和 Kit ,IC₅₀ 分别为 28 和 16 nM。

别名 : PLX-3397; Pexidartinib ; 3-Pyridinemethanamine,

N-[5-[(5-chloro-1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-3-yl)methyl]-2-pyridinyl]-6-(trifluoromethyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至卡其色固体

溶解性 :DMSO 83 mg/mL (198.65 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	Pexidartinib (PLX3397)是一种口服有效的多靶点 CSF-1R ,Kit ,和 Flt3 受体酪氨酸激酶抑制剂, 其 IC ₅₀ 分别为 20 nM, 10 nM 和 160 nM。		
靶点	Kit (Cell-free assay) 10 nM	CSF-1R (Cell-free assay) 20 nM	Flt3 (Cell-free assay) 160 nM
体外研究	在 M-NFS-60 , Bac1.2F5 和 M-07e 细胞中, Pexidartinib 抑制 CSF1 依赖性增殖, IC ₅₀ 分别为 0.44μM , 0.22μM 和 0.1μM。		
体内研究	在 MMTV-PyMT 小鼠中, Pexidartinib (40 mg/kg, p.o.)显著抑制稳态和 PTX 诱导的肿瘤通过 CD45+CD11b+Ly6C-Ly6G-F4/80+ 浸润。Pexidartinib/PTX 治疗也会导致乳腺肿瘤内 CD31+ 血管密度显著减少, 伴随细胞凋亡和坏死的诱导。在负荷 GL261 肿瘤的 C57 小鼠中, Pexidartinib (p.o.)抑制恶性胶质瘤细胞侵袭。在 cmo 小鼠中, PLX3397 通过减少尾巴和爪子中腐蚀性骨损伤和循环 MIP-1α 的水平, 显著减弱自身炎症疾病。在负荷 B16F10 黑色素瘤		

的小鼠中，Pexidartinib (45 mg/kg, p.o.)增强 CD8 介导的黑色素瘤免疫疗法。

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。Pexidartinib (PLX3397) 是一种口服有效的多靶点 CSF-1R, Kit, 和 Flt3 受体酪氨酸激酶抑制剂。可用于相关领域的科研实验。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3934 mL	11.9672 mL	23.9343 mL
5 mM	0.4787 mL	2.3934 mL	4.7869 mL
10 mM	0.2393 mL	1.1967 mL	2.3934 mL
50 mM	0.0479 mL	0.2393 mL	0.4787 mL

经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）

动物实验	Animal Models: MMTV-PyMT 小鼠 Formulation: 在小鼠食物中配制 Dosages: 40 mg/kg/day Administration: p.o.
-------------	---

【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。