

LY2874455

产品编号: MB4645

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg/25mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C21H19Cl2N5O2	结构式	
分子量	444.31		
CAS No.	1254473-64-7		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble		
	DMSO: 88 mg/mL (198.06 mM)		
	Ethanol: 88 mg/mL (198.06 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
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: LY2874455 是一个泛 FGFR 的抑制剂, 对 FGFR1, FGFR2, FGFR3, 和 FGFR4 的 IC50 值分别为 2.8 nM, 2.6 nM, 6.4 nM, 以及 6 nM。并且也能抑制 VEGFR2 的活性, IC50 为 7 nM。Phase 1。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: Ethanol: 88 mg/mL (198.06 mM) (warmed with 50℃ water bath); DMSO: 88 mg/mL (198.06 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	LY2874455 是一个泛 FGFR 的抑制剂, 对 FGFR1, FGFR2, FGFR3, 和 FGFR4 的 IC50 值分别为 2.8 nM, 2.6 nM, 6.4 nM, 以及 6 nM。并且也能抑制 VEGFR2 的活性, IC50 为 7 nM。Phase 1。				
IC50 & Target	FGFR2 (Cell-free assay)	FGFR1 (Cell-free assay)	FGFR4 (Cell-free assay)	FGFR3 (Cell-free assay)	VEGFR2 (Cell-free assay)
	2.6 nM	2.8 nM	6 nM	6.4 nM	7 nM
体外	在 RT-112 细胞, HUVECs, KATO-III 细胞, 和 SNU-16 细胞, LY2874455 抑制 FGF/FGFR 介导的信号活性。LY2874455 在 KMS-11, OPM-2, SNU-16 和 KATO-III 细胞中表现出 FGFR 依赖性抗增殖作用。				

体内	在小鼠心脏组织中，LY2874455 对 FGF 诱导的 Erk 磷酸化表现出有效的抑制作用，TED50 和 TED90 值分别为 1.3 和 3.2 mg/kg。在负荷 RT-112, OPM-2 (DSMZ), SNU-16, 或 NCI-H460 异种植物的小鼠体内，LY2874455 (3 mg/kg p.o.)剂量依赖性抑制肿瘤生长。
激酶实验	生化过滤结合测定以检测 FGFR 磷酸化活性： 反应混合物包含 8 mM Tris-HCl (pH 7.5), 10 mmol/L HEPES, 5 mM 二硫苏糖醇, 10 μM ATP, 0.5 μCi 33P-ATP, 10 mM MnCl ₂ , 150 mM NaCl, 0.01% Triton X-100, 4% 二甲基亚砷, 0.05 mg/mL poly(Glu:Tyr) (4:1, 平均分子量为 20–50 kDa), 以及 7.5 ng FGFR1, 7.5 ng FGFR3, 和 16 ng FGFR4, 在室温下培养 30 分钟, 然后用 10% H ₃ PO ₄ 终止。将反应混合物转移到 96 孔 MAFB 滤板, 用 0.5% H ₃ PO ₄ 清洗 3 次。空气干燥后, 将板用 Trilux 阅读器读取数据。
细胞实验	Cell lines: KMS-11, OPM-2, L-363, U266, SNU-16, KATO-III, NUGC-3 和 SH-10-TC 细胞 Concentrations: ~1 μM Incubation Time: 72 小时 Method: Cells (2,000 每孔)首先在 RPMI 中生长 6 小时, 然后用 LY2874455 在 37°C 下处理 3 天。细胞在 37°C 下着色 4 小时, 然后在 37°C 下溶解 1 小时。最后, 板在 570 nm 下使用板阅读器(Spectra Max Gemini XS)读取数据。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: 负荷 RT-112, OPM-2 (DSMZ), SNU-16, 或 NCI-H460 异种植物的小鼠 Formulation: 10% Acacia Dosages: 3 mg/kg Administration: p.o. (Only for Reference)

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)

MB0936	Derazantinib(ARQ087)
MB3898	Danuserib (PHA-739358)
MB4637	NSC-12

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热(在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 DMSO 质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.2507 mL	11.2534 mL
5 mM	0.4501 mL	2.2507 mL	4.5014 mL
10 mM	0.2251 mL	1.1253 mL	2.2507 mL

50 mM	0.0450 mL	0.2251 mL	0.4501 mL
-------	-----------	-----------	-----------

【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，否则会严重影响化合物活性，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。