

AVL-292 ; AVL292

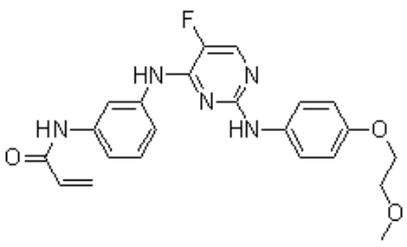
产品编号 : MB5288

质量标准 : >98%,高度选择性的 BTK 抑制剂

包装规格 : 5MG;20MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H22FN5O3	结 构 式	
分子量	423.44		
CAS No.	1202757-89-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 85 mg/mL (200.73 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 : Spebrutinib (AVL-292; CC-292) 是共价, 高选择性和口服活性的 Btk 抑制剂。

别名 : AVL-292; CC-292 ; 2-Propenamide, N-[3-[[5-fluoro-2-[[4-(2-methoxyethoxy)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]amino]phenyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至卡其色固体

溶解性 :DMSO : 85 mg/mL (200.73 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	CC-292 (AVL-292)是一个通过共价结合的, 可以口服, 并且具有高度选择性的 BTK 抑制剂, 其 IC50 小于 0.5 nM, 展示了比其他被测激酶至少 1400 倍的选择性。
特性	口服生物可利用的 btk 选择性抑制剂, 已在治疗复发或难治性 b-nhl、cII 和 wm 的第一阶段临床试验中进行试验。
靶点	BTK

	(Cell-free assay)
	<0.5 nM
体外研究	AVL-292 在 Ramos 细胞中对 BTK 产生了剂量依赖性的抑制作用，其 EC50 为 8 nM；并且抑制了下游的 BCR 通路。AVL-292 通过抑制 BTK 的活性，进一步的抑制了 B 细胞的增殖，其 EC50 为 3 nM。
体内研究	在胶原蛋白诱导的小鼠关节炎模型中，AVL-292 (3- 30 mg/kg, p.o.)剂量依赖性的抑制了这类炎症的临床症状，包括关节和爪子的肿胀度以及受影响爪子发红症状的减少。

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)

MB5612	依鲁替尼(PCI32765)
MB4286	Acalabrutinib(ACP-196)

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。本品是一个通过共价结合的，可以口服，并且具有高度选择性的 BTK 抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3616 mL	11.8080 mL	23.6161 mL
5 mM	0.4723 mL	2.3616 mL	4.7232 mL
10 mM	0.2362 mL	1.1808 mL	2.3616 mL
50 mM	0.0472 mL	0.2362 mL	0.4723 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>BTK OMNIA 测试过程:</p> <p>实验条件包括，40 μM ATP (1X K_{MATP}), 10 μM Y5-Sox, and 10 nM BTK 酶. 简言之, 将由 1.13X ATP and the Y5 Sox 组成的底物混合物放入由 20 mM Tris, pH 7.5, 5 mM $MgCl_2$, 1 mM EGTA, 5 mM β-甘油磷酸, 5% 甘油, 和 0.2 mM DTT 组成的 1X Omnia 激酶反应缓冲液中. 关于 IC50 测定, 将 5 μL 酶和以三倍比例稀释的抑制剂放入到 50% DMSO 中, 25°C 孵育 30 min. 激酶反应从加入 45 μL ATP/Y5 底物混合物开始计时, 用 Synergy 4 plate reader 在 λex360/λem485 处检测 60 分钟. 将每个小孔的反应根据 GraphPad 软件制作成动力学曲线从而计算出 IC50 值.</p>
-------------	---

细胞实验	<p>Cell lines: 人源 B 细胞</p> <p>Concentrations: ~1000 nM</p> <p>Incubation Time: 72 hours</p> <p>Method: 用负选择的方式分离天然人源 B 细胞并用 RPMI 稀释为 $0.4-0.5 \times 10^6$ cells/ml 的悬浮液。将细胞与 α-human IgM (每孔终浓度 5 μg/ml) 混合, 然后加入 DMSO 或者 AVL-292 (每孔终浓度分别为 0.01, 0.1, 1.0, 10.0, 100.0, 1000 nM), 放入 96 孔板中. 细胞在 37°C, 5% CO₂ 的培养箱中孵育 56 小时. 然后加入 ³H-Thymidine(每孔终浓度 1 μCi), 培养过夜后检测 ³H 含量. 实验进行三次。</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。