

SB-1317,TG-02 ; SB1317,TG02

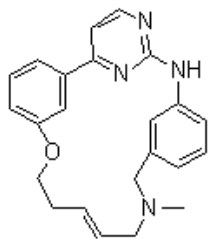
产品编号 : MB5456

质量标准 : >97%,CDKs/JAK2 / FLT3 抑制剂

包装规格 : 10MG;100MG;1G

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C23H24N4O	结 构 式	
分子量	372.46		
CAS No.	937270-47-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 26.5 mg/mL (71.15 mM; Need ultrasonic and warming)		
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 : SB1317 是一种有效的 CDK2, JAK2 和 FLT3 抑制剂。**别名 :** TG02 ; 20-Oxa-5,7,14,27-tetraazatetracyclo[19.3.1.12,6.18,12]heptacosa-1(25),2,4,6(27),8,10,12(26),16,21,23- decaene, 14-methyl**物理性状及指标 :**

外观 :白色或类白色固体

溶解性 :DMSO : 26.5 mg/mL (71.15 mM; Need ultrasonic and warming)

含量 :>97%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥**生物活性**

产品描述	SB1317 是一种有效的 CDK2, JAK2 和 FLT3 抑制剂, IC ₅₀ 分别为 13, 73 和 56 nM。		
靶点	CDK2	JAK2	FLT3
	13 nM (IC ₅₀)	73 nM (IC ₅₀)	56 nM (IC ₅₀)
体外研究	SB1317 具有一个高度新颖的激酶抑制谱, 抑制 63 种激酶中的 17 种, 其中 11 种是 CDK/JAK/FLT 家族成员。其他的, lck, fyn, fms, tyro3, erk5 和 p38δ, 与炎症和增殖过程有关。在最高试验浓度 25μm 时, SB1317 不抑制人 CYP1A2、3A4、2C9 和 2C19 亚型, 但 SB1317 抑制 CYP2D6, IC ₅₀ =0.95μm, 大约在最大耐受剂量下观察到的血浆 C _{max} 。SB1317		

	抑制 HCT-116 (IC ₅₀ =0.079μm) 和 HL-60 (IC ₅₀ =0.059μm) 中的细胞增殖浓度。SB1317 是一种新型的小分子高效 CDK/JAK2/FLT3 抑制剂。SB1317 在体外主要由 cyp3a4 和 cy1a2 代谢。除了 cyp2d6 (IC ₅₀ =1μm)，SB1317 在体外不抑制任何主要的人 cyp。SB1317 在体外对人肝细胞无明显诱导作用。
体内研究	以 75 mg/kg po q.d.3×/周的剂量治疗 SB1317 可显著抑制肿瘤生长，平均 TGI 为 82%，而较低剂量 50 mg/kg po 3×/周的治疗效果微乎其微。使用任何一种方案的 SB1317 治疗均能显著抑制肿瘤的生长，口服和 IP 给药方法的平均 TGIS 分别为 42%和 63%。在药代动力学研究中，SB1317 显示，小鼠、大鼠和狗体内的中到高系统清除率（相对于肝血流量）、高分布量（>0.6 l/kg）、口服生物利用度分别为 24%、4%和 37%；小鼠体内的组织广泛分布。

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)

MB4025	PHA-793887
MB4022	SNS-032 (BMS-387032)

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。SB1317 是一种有效的 CDK2，JAK2 和 FLT3 抑制剂，本品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	2.6849 mL	13.4243 mL	26.8485 mL
5 mM	0.5370 mL	2.6849 mL	5.3697 mL
10 mM	0.2685 mL	1.3424 mL	2.6849 mL

经典实验操作（源自公开文献，仅供参考）

激酶实验	使用重组酶（CDK2/细胞周期蛋白 A、JAK2 和 FLT3）。使用 pklight 分析系统在 384 孔滴定板中进行所有分析。该分析平台是利用荧光素酶偶联反应检测反应中三磷酸腺苷的光度分析。从 10μm 开始，以 3 倍或 4 倍连续稀释制备的 8 种浓度对化合物进行测试。对于 CDK2/cyclin A 分析，反应混合物由以下成分组成：25μl 分析缓冲液（50 mM HEPES，pH7.5，10 mM MgCl ₂ ，5 mM MnCl ₂ ，5 mM BGP，1 mM DTT，0.1 mM 原钒酸钠），1.4μg/ml CDK2/cyclin A COMPLEX、0.5μm 的研磨基板和 0.5μm 的 ATP。将混合物在室温下培养 2 小时，然后加入 13μl pklight ATP 检测试剂，培养 10 分钟，在多标板阅读器上检测发光信号。分析软件 Prism 5.0 用于根据数据生成 IC ₅₀ 值。
细胞实验	SB1317 在 DMSO 中制备并储存，然后在使用前用适当的培养基稀释。 对于 96 孔板中的增殖测定，将 20000 个细胞接种在 100μL 培养基中，并在第二天用化合物（例如 SB1317）（一式三份）以高达 10μM 的浓度处理 48 小时。使用 CellTiter-96 Aqueous One 溶液细胞增殖测定监测细胞活力。绘制剂量 - 反应曲线以使用 XL-fit 软件确定化合物的 IC ₅₀ 值。
动物实验	将 SB1317 盐酸盐溶于 0.5%甲基纤维素/0.1%吐温 80（MC / Tween）中用于口服（po）给药或在 10%二甲基乙酰胺（DMA）和 10% Cremophor（DMA / CRE）中用于 ip 给

药。每周以每千克体重 10mL 的进料体积制备给药溶液，并在 4°C 下储存。

小鼠和大鼠

雄性 BALB / c 小鼠（年龄约 10-12 周，体重 17-22g），雄性 Beagle 犬（约 6-7 个月，体重 10-14kg）和雄性 Wistar 大鼠（6-8 周龄，在该研究中使用重量为 239-249g）。小鼠，狗和大鼠的口服剂量分别为 75,10 和 10mg / kg。通过管饲法将剂量作为悬浮液（0.5% 甲基纤维素和 0.1% 吐温 80）给予小鼠和大鼠，并作为明胶胶囊（12 只 Torpac）给予狗。口服给药后，在含有 K3EDTA 作为抗凝血剂的试管中，在不同时间点（0-24 小时）收集连续血样（小鼠心脏穿刺，小鼠颈静脉和大鼠上腔静脉），离心，分离血浆，储存在 -70°C 直至分析。通过 LC-MS / MS 处理和分析血浆样品。使用 WinNonlin 通过非房室方法估计药代动力学参数。

【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
狻狻	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。