

BGJ398 ; NVP-BGJ398

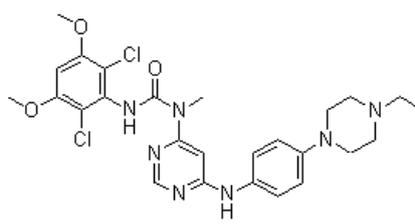
产品编号 : MB5516

质量标准 : >98%,FGFR 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₃₁ Cl ₂ N ₇ O ₃	结 构 式	
分子量	560.48		
CAS No.	872511-34-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 1 mg/mL warmed (1.78 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 : Infigratinib (BGJ-398) 是 FGFR 家族的有效抑制剂, 抑制 FGFR1, FGFR2, FGFR3 和 FGFR4。

别名 : BGJ-398; NVP-BGJ398 ; Urea, N'-(2,6-dichloro-3,5-dimethoxyphenyl)-N-[6-[[4-(4-ethyl-1-piperazinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]-N-methyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 1 mg/mL warmed (1.78 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	BGJ398 (NVP-BGJ398)是一种有效的, 选择性 FGFR 抑制剂, 作用于 FGFR1/2/3, 在无细胞试验中 IC ₅₀ 为 0.9 nM/1.4 nM/1 nM, 作用于 FGFR 比作用于 FGFR4 和 VEGFR2 选择性高 40 倍以上, 对 Abl, Fyn, Kit, Lck, Lyn 和 Yes 几乎没有抑制活性。Phase 2。				
靶点	FGFR1 (Cell-free assay)	FGFR3 (Cell-free assay)	FGFR2 (Cell-free assay)	FGFR3 (K650E) (Cell-free assay)	FGFR4 (Cell-free assay)

	0.9 nM	1.0 nM	1.4 nM	4.9 nM	60 nM
体外研究	BGJ398 抑制 FGFR3-K650E, IC50 为 4.9 nM。此外, BGJ398 也抑制 VEGFR2。BGJ398 抑制其他激酶, 包括 ABL, FYN, KIT, LCK, LYN 和 YES, IC50 分别为 2.3 μM, 1.9 μM, 0.75 μM, 2.5 μM, 0.3 μM 和 1.1 μM。在细胞水平, BGJ398 抑制 FGFR1-, FGFR2-Q, 和 FGFR3-依赖的 BaF3 细胞增殖, IC50 分别为 2.9 μM, 2.0 μM 和 2 μM。BGJ398 在特定酪氨酸残基, 包括 FGFR-WT, FGFR2-WT, FGFR3-K650E, FGFR3-S249C 和 FGFR4-WT 处, 干扰自磷酸化, IC50 分别为 4.6 nM, 4.9 nM, 5 nM, 5 nM 和 168 nM。BGJ398 抑制过量表达野生型 (WT)FGFR3 的癌细胞, 如 RT112, RT4, SW780 和 JMSU1 的增殖, IC50 分别为 5 nM, 30 nM, 32 nM 和 15 nM。				
体内研究	BGJ398 按 10 和 30 mg/kg 剂量, 分别处理原位移植膀胱癌模型, 持续 12 天, 则抑制肿瘤生长, 和引起淤血。BGJ398 按 10 mg/kg 剂量处理实验动物, 体重没有改变, 按 30 mg/kg 剂量处理, 则体重增加 10%。BGJ398 磷酸盐按 4.25 和 8.51 mg/kg 剂量口服处理给药携带 RT112 肿瘤的雌性 Rowett 大鼠。BGJ398 显著降低 pFRS2 和 pMAPK 水平, 这种作用存在剂量依赖性。BGJ398 显著抑制 bFGF 刺激的血管生成, 这种作用存在剂量依赖性。然而, BGJ398 不损害 VEGF 诱导的血管形成。				

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)

MB5756	AZD4547
MB5516	BGJ398(NVP-BGJ398)
MB7546	BLU9931

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。Infigratinib (BGJ-398) 是 FGFR 家族的有效抑制剂, 抑制作用于 FGFR1, FGFR2, FGFR3 和 FGFR4。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	1.7842 mL	8.9209 mL	17.8418 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作（仅供参考）

<p>激酶实验</p>	<p>放射性激酶实验:</p> <p>在有放射性标记 ATP 存在时, 通过纯化的 GST-融合 FGFR3-K650E 激酶域, 测定合成底物的磷酸化, 而测定激酶活性。通过混合 10 μL 3 倍浓度 BGJ398 溶液和 10 μL 相应底物混合物 (肽底物, ATP 和 [γ-³³P]ATP)测定酶活性。在实验 buffer 中加入 10 μL 3 倍浓度酶溶液开始反应。实验组成的终浓度如下: 10 ng GST-FGFR3-K650E, 20 mM Tris-HCl, pH 7.5, 3 mM MnCl₂, 3 mM MgCl₂, 1 mM DTT, 250 μg/mL PEG 20000, 2 μg/mL 聚(EY) 4:1, 1% DMSO 及 0.5 μM ATP (γ-[³³P]-ATP 0.1 μCi)。包括 BGJ398 的终体积为 30 μL 的实验混合物根据过滤结合 (FB)法在 96 孔板上室温下进行实验 10 分钟。加入 20 μL 125 mM EDTA 终止酶反应,按如下测定 ³³P 渗透到肽底物的量: 30 μL 终止反应混合物转移到 Immobilon-PVDF 膜上, 之前用甲醇浸泡膜 5 分钟, 用水冲洗,用 0.5% H₃PO₄ 浸泡 5 分钟, 然后安装在真空歧管中。点样,连接真空, 然后使用 0.5% H₃PO₄ (200 μL)冲洗细胞。 移除膜, 在摇床上使用 1% H₃PO₄ 处理四次, 再使用乙醇处理一次。烘干膜, 在膜上每孔覆盖 10 μL 闪烁液。封闭实验板, 在微板闪烁计数板上读数。通过线性回归分析 BGJ398 抑制百分数, 而计算 IC₅₀ 值。</p>
<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: 鼠 BaF3 细胞系 Concentrations: 0 μM-0.1 μM Incubation Time: 48 小时 Method: Murine 鼠 BaF3 细胞系接种在含 10% FBS, 4.5 g/L 葡萄糖, 1.5 g/L 碳酸氢钠, 和 Pen/Strep 的 RPMI-1640 培养基上。每周细胞传代两次。使用荧光素酶生物发光法检测测定 BGJ398 调节的抑制 BaF3 细胞增殖和活性。BaF3 或 BaF3 Tel-TK 细胞按每孔 4250 个细胞接种到 384 孔板上, 在新鲜培养基中使用 μFill 液体分配器每孔加 50 μL。BGJ398 在 DMSO 中连续稀释, 然后排列在 384 孔板中。使用 pintool 传输设备使 50 nL BGJ398 转移到含细胞的实验板上, 然后实验板在 37°C(5% CO₂) 下温育 48 小时。然后加入 25 μL Bright-Glo,使用 Analyst-GT 测定荧光。测定 IC₅₀ 值。 (Only for Reference)</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 携带亲本 RT112 细胞系的无胸腺裸鼠 Formulation: PEG300/D5W (2:1, v/v) Dosages: 10 mg/kg/qd 和 30 mg/kg/qd Administration: 口服处理</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，否则会影影响化合物活性，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。