

依鲁替尼(PCI32765) ; Ibrutinib ; PCI-32765

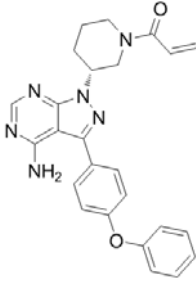
产品编号 : MB5612

质量标准 : ≥98%,BTK 抑制剂

包装规格 : 100MG ; 1G

产品形式 : 白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₄ N ₆ O ₂	结 构 式	
分子量	440.50		
CAS No.	936563-96-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 88 mg/mL (199.77 mM) Water: Insoluble Ethanol: 45 mg/mL (102.15 mM)		
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: 依鲁替尼 PCI-32765 是选择性, 不可逆的 Btk 抑制剂, IC₅₀ 值为 0.5 nM。

别名: Ibrutinib ; PCI-32765 ; 依鲁替尼

1-[(3R)-3-[4-Amino-3-(4-phenoxyphenyl)-1H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-1-yl]-1-piperidinyl]-2-propen-1-one

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO 88 mg/mL (199.77 mM);Ethanol 45 mg/mL (102.15 mM);Water 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	Ibrutinib (PCI-32765)是一种有效的, 高选择性的 Brutons tyrosine kinase (Btk)抑制剂, 无细胞试验中 IC ₅₀ 为 0.5 nM,对 Bmx, CSK, FGR, BRK 及 HCK 适度有效,对 EGFR, Yes, ErbB2, JAK3 等作用效果较弱。				
靶点	BTK (Cell-free assay)	BLK (Cell-free assay)	Bmx (Cell-free assay)	CSK (Cell-free assay)	FGR (Cell-free assay)
	0.5 nM	0.5 nM	0.8 nM	2.3 nM	2.3 nM
体外研究	Ibrutinib 有效可逆且选择性抑制 Btk 酶活性。Ibrutinib 作用于 BCR 通路激活的 DOHH2 细胞系, 抑制 Btk 自磷酸化, Btk's 生理底物 PLCγ 磷酸化, 和更远一点的下流激酶 ERK 的磷酸化, IC ₅₀ 分别为 11 nM, 29 nM 和 13 nM。Ibrutinib 作用于慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 细				



	胞, 诱导细胞毒性, 这种作用存在剂量和时间依赖性。此外, Ibrutinib 诱导 caspase 依赖性细胞死亡通路激活, 且在 TLR 信号后, 抑制 CLL 细胞增殖能力。最新研究显示 Ibrutinib 抑制 BCR 激活的原代 B 细胞增殖, IC50 为 8 nM, 且抑制原代单核细胞中 TNF α , IL-1 β 和 IL-6 产量, IC50 分别为 2.6 nM, 0.5 nM, 和 3.9 nM。
体外研究	Ibrutinib 作用于胶原诱导的关节炎模型, 通过抑制 B 细胞活性, 显著降低足肿胀和关节发炎等临床关节炎症状。Ibrutinib 作用于 MRL-Fas(lpr) 狼疮模型, 降低肾疾病和自身抗体产量。Ibrutinib 每天按 25 mg/kg 剂量作用于过继转移 TCL1 的 CLL 小鼠模型, 产生短暂的早期淋巴瘤细胞增多症, 且延迟 CLL 疾病进展。

美仑相关产品推荐

MB5288	AVL292
CL-10269	GDC-0834

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。依鲁替尼 PCI-32765 是选择性, 不可逆的 Btk 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	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2701 mL	11.3507 mL	22.7015 mL
5 mM	0.4540 mL	2.2701 mL	4.5403 mL
10 mM	0.2270 mL	1.1351 mL	2.2701 mL
50 mM	0.0454 mL	0.2270 mL	0.4540 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验	激酶, ³³ P-ATP, Ibrutinib, 和底物 [0.2 mg/mL 聚(EY)(4:1)]温育 1 小时后, 使用 ³³ P 过滤结合实验测量体外激酶 IC50 值。
细胞实验	Cell lines: 慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 细胞 Concentrations: 0.01 μ M 到 100 μ M Incubation Time: 48 小时 Method: 进行 MTT 实验测定细胞毒性。细胞 (CLL B 细胞或健康志愿者 T 细胞或 NK 细胞) 和不同浓度 Ibrutinib 温育 48 小时。加入 MTT 试剂, 实验板再温育 20 小时, 然后使用溶于 PBS 的硫酸鱼精蛋白冲洗。加入 DMSO, 通过分光光度法使用 Labsystems 酶标仪, 在 540 nm 处测定吸光值。使用膜联蛋白/PI 流式细胞仪在不同时间点测量细胞活力。使用 Expo-ADC32 软件包分析数据。结果表示为总阳性细胞与对照组之比的百分数。加入 100 μ M Z-VAD 检测 caspase 依赖性凋亡。
动物实验	Animal Models: MRL-Fas(lpr) 狼疮模型和胶原诱导的关节炎模型 Formulation: Ibrutinib 溶于 DMSO Dosages: \leq 50 mg/kg Administration: 口服处理

【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(M ²)	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。

