

INCB28060

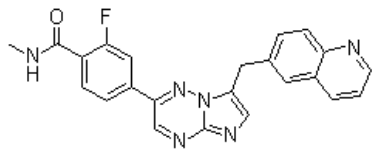
产品编号：MB5669

质量标准：>98,ATP 竞争性的 c-MET 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C23H17FN6O	结 构 式	
分子量	412.42		
CAS No.	1029712-80-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 2 mg/mL (4.84 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：Capmatinib (INCB28060) 是一种有效的选择性 c-MET 激酶抑制剂。**别名：**苯扎米特；INCB28060; INC-280；Benzamide, 2-fluoro-N-methyl-4-[7-(6-quinolinylmethyl)imidazo[1,2-b][1,2,4]triazin-2-yl]-**物理性状及指标：**

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 2 mg/mL (4.84 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	Capmatinib (INCB28060)是一种新型的，ATP 竞争性 c-MET 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 0.13 nM，对 RONβ，EGFR 和 HER-3 无活性。
特性	INCB28060 对 c-MET RTK 家族的 RONβ 以及 EGFR RTK 家族的 EGFR 和 HER-3 不具有活性。
靶点	c-Met (Cell-free assay)

	0.13 nM
体外研究	INCB28060 具有皮摩尔酶活效价，对 c-MET 选择性比其它大部分人源激酶高出 10000 多倍。在肿瘤细胞里 INCB28060 可以抑制 c-MET 磷酸化以及 c-MET 介导的信号转导。INCB28060 抑制 c-MET 依赖的细胞增殖和存活并且抑制 anchorage 非依赖性肿瘤细胞生长和细胞迁移。
体内研究	在 c-MET 依赖的小鼠肿瘤模型中 INCB28060 具有很强的抗肿瘤活性，即使 0.03 mg/kg 口服量对 c-MET 磷酸化的抑制率也大约有 50%。在携带肿瘤的小鼠上 INCB28060 对肿瘤生长的抑制作用具有剂量依赖特性

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)

MB5240	JNJ38877605
MB3950	MK-2461
MB8803	PHA-665752

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。Capmatinib (INCB28060) 是一种有效的选择性 c-MET 激酶抑制剂。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	2.4247 mL	12.1236 mL	24.2471 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>c-Met 激酶活性分析:</p> <p>分析缓冲液含有 50 mM Tris-HCl, 10 mM MgCl₂, 100 mM NaCl, 0.1 mg/mL BSA, 5mM DTT, pH 7.8。对于 HTS 分析 0.8 μL 5 mM 溶于 DMSO 的 INCB28060 点在 384 孔板中。DMSO 滴定法分析显示该溶剂最大接受浓度为 4%。为了测量 IC₅₀ 值，将 INCB28060 连续稀释 11 次每次三倍加入平板中待用。从上述平板中吸取 0.8 μL 溶于 DMSO 的 INCB28060 转移到分析平板。DMSO 终浓度 2%。在分析缓冲液中准备 8 nM 未磷酸化的 c-Met 或 0.5 nM 磷酸化的 c-Met。</p>
-------------	--

	<p>1 mM 溶于 DMSO 的多肽底物 Biotin-EQEDEPEGDYFEWLE-amide 用分析缓冲液稀释到 1 μM, 缓冲液含有 400 μM ATP (未磷酸化 c-Met) 或 160μM ATP (磷酸化 c-Met). 每个相应孔中加入 20 μL 酶溶液 (或分析缓冲液作为对照) 然后加入 20 μL 底物溶液起始反应。平板 25 $^{\circ}$C 孵育 90 分钟, 避光。加入 20 μL 终止液结束反应, 终止液包含 45 mM EDTA, 50 mM Tris-HCl, 50 mM NaCl, 0.4 mg/ mL BSA, 200 nM SA-APC 和 3 nM EUPy20。室温孵育 15-30 分钟然后在 Perkin Elmer Fusion α-FP 仪器中进行均相时间分辨荧光分析 (HTRF)。HTRF 程序如下: Primary excitation filter 330/30, Primary window: 200 uSec, Primary delay: 50 uSec, Number of flashes: 15, Well read time: 2000</p>
细胞实验	<p>Cell lines: H441 细胞 Concentrations: 0.24, 1, 4, 16, 63 nM Incubation Time: 24 小时 Method: H441 细胞培养在含有 10%胎牛血清的 RPMI-1640 培养基中, 使之长满。用 P200 的移液器 tip 头在细胞间划出空隙。然后在不同浓度 INCB28060 条件下加入 50 ng/mL 重组人源 HGF 诱导细胞跨空隙迁移。孵育过夜后, 拍好相应照片并分析半迁移抑制情况。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 8 周龄大雌性 Balb/c nu/nu 小鼠(Charles River), 皮下接种 4×10^6 个肿瘤细胞(S114 模型)或 5×10^6 肿瘤细胞(U-87MG 恶性胶质瘤模型) Formulation: 在 DMSO 中配成 5 mmol/L 的储存液, 室温保存 Dosages: 3, 10, 30 mg/kg Administration: 口服, 一天两次</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。