

UNC2250

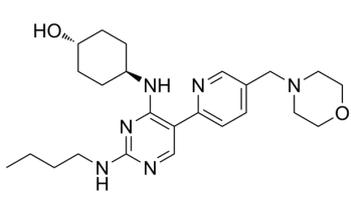
产品编号: MC8012

质量标准: >98%, BR

包装规格: 1mg / 5mg / 10mg / 50mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₂₄ H ₃₆ N ₆ O ₂	结 构 式	
分子量	440.58		
CAS No.	1493694-70-4		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
运输条件	湿冰运输 (按季节)		

简介: UNC2250 是一种有效选择性的 Mer 抑制剂, IC₅₀ 为 1.7nM, 比相关的激酶 Axl 和 Tyro3 选择性高 160 倍和 60 倍。

别名: UNC-2250

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 2mg/mL

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>98%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。UNC2250 有效地抑制 697 B-ALL 细胞和 Colo699 NSCLC 细胞中 Mer 的磷酸化。此外, UNC2250 也可以通过降低杆状肿瘤细胞和 NSCLC 细胞中集落形成的潜能而表现出功能性抗肿瘤活性。

生物活性:

靶点	Axl; Mer
体外研究	UNC2250 (5-500 nM;1 h)抑制 697 B-ALL 细胞中 Mer 磷酸化, 其 IC ₅₀ 值为 9.8 nM ^[1] ; 一种嵌合蛋白由表皮生长因子(EGF)受体的胞外和跨膜结构域以及 Mer 的胞内酪氨酸激酶结构域组成, UNC2250 可有效抑制这种嵌合蛋白的配体依赖性磷酸化 ^[1] ; 在软琼脂培养中, UNC2250 抑制 BT-12 横纹肌样瘤和 Colo699 NSCLC 细胞系的集落形成 ^[1] 。

溶液配制:

制备储备液	溶剂体积 / 质量		1mg	5mg	10mg
	浓度				
	1mM		2.2697 mL	11.3487 mL	22.6974 mL
	5mM		0.4539 mL	2.2697 mL	4.5395 mL
	10mM		0.2270 mL	1.1349 mL	2.2697 mL

使用方法: (仅供参考)



激酶试验	活性测定在 384 孔聚丙烯微型板中进行，每种酶使用终体积为 50 μ L 的 50mM HEPES, pH 7.4, 包含 10mM MgCl ₂ , 1.0mM DTT, 0.01% Triton X-100, 0.1%牛血清蛋白(BSA), 包含 1.0 μ M 荧光基质和 ATP。所有反应通过加入 20 μ L 的 70mM EDTA 而终止。180 分钟培育之后，磷酸化的和非磷酸化的基底肽被分开放在缓冲液中，在配备 12-sipper 芯片的 LabChip EZ 阅读器上用 1 \times CR-8 进行补充。使用 EZ 阅读软件进行数据分析。
细胞试验	Cell lines: BT-12 杆状肿瘤细胞，以及 Colo699 NSCLC 细胞 Concentrations: BT-12 为~3 μ M, Colo699 为~300nM Incubation Time: BT-12 为 3 周，Colo699 为 2 周 Method: BT-12 杆状肿瘤细胞(10000 个细胞)在 2mL 0.35%软琼脂中进行培养，其包含 0.5 \times RPMI 培养基，7.5% FBS，指示浓度为含抑制剂或仅 DMSO 载体，并且覆盖 0.5mL 包含 15% FBS 和抑制剂或仅 DMSO 载体的 1 \times RPMI 培养基。培养基和抑制剂或载体每周更换两次。菌落用噻唑蓝溴化四唑着色，三周后开始计数。Colo699 NSCLC 细胞（15000 个细胞）在 1.5mL 0.35%软琼脂中进行培养，其包含 1 \times RPMI 培养基和 10% FBS，并且覆盖 2mL 包含 10% FBS 和含抑制剂或仅 DMSO 载体指示浓度的 1 \times RPMI 培养基。培养基和抑制剂或载体每周更换三次。菌落用氯化硝基四氮唑蓝着色，并在两周后开始计数。

【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（如 0.22 μ m 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

[1]. Zhang, W., et al., Pseudo-cyclization through intramolecular hydrogen bond enables discovery of pyridine substituted pyrimidines as new Mer kinase inhibitors. J Med Chem, 2013. 56(23): p. 9683-92.

S241001

