

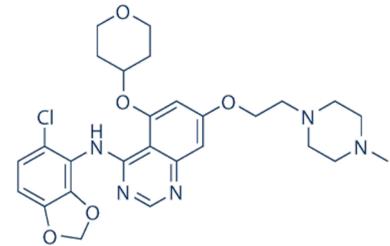
Saracatinib (Src抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1040-10mM	Saracatinib (Src抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1040-5mg	Saracatinib (Src抑制剂)	5mg
SC1040-25mg	Saracatinib (Src抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-(5-chloro-1,3-benzodioxol-4-yl)-7-[2-(4-methylpiperazin-1-yl)ethoxy]-5-(oxan-4-yloxy)quinazolin-4-amine
简称	Saracatinib
别名	AZD0530, AZD 0530, AZD-0530, AZD0530 Difumarate, Saracatinib difumarate
中文名	塞卡替尼
化学式	C ₂₇ H ₃₂ ClN ₅ O ₅
分子量	542.03
CAS号	379231-04-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 35mg/ml; Ethanol 31mg/ml
溶液配制	5mg加入0.92ml DMSO, 或每5.42mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1040-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Saracatinib (AZD0530)是一种有效的Src抑制剂, 无细胞试验中IC ₅₀ 为2.7nM, 对c-Yes、Fyn、Lyn、Blk、Fgr和Lck也具有活性; 但对Abl和EGFR (L858R和L861Q)活性较低。Phase 2/3。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	c-Src	LCK	c-YES	EGFR (L861Q)	Lyn
IC ₅₀	2.7nM	<4nM	4nM	4nM	5nM
体外研究	Saracatinib也有效抑制其他Src酪氨酸激酶家族成员, 包括c-Yes、Fyn、Lyn、Blk、Fgr和Lck, IC ₅₀ 为4到10nM。Saracatinib有效抑制SrcY530F突变的NIH 3T3细胞, IC ₅₀ 为80nM。在NBT-II膀胱癌细胞中, Saracatinib显著阻断HT1080细胞通过立体骨胶原基质的入侵, 且完全抑制EGF诱导的细胞分散。Saracatinib作用于DU145和PC3细胞, 通过抑制Y419磷酸化而有效抑制Src激活。Saracatinib抑制前列腺癌包括PC3、DU145、CWR22Rv1和LNCaP的生长, 而Saracatinib作用于LAPC-4、PZ-HPV7和RWPE-1细胞时却显示低活性。Saracatinib使细胞周期停止在G1/S期, 但是不使caspase 3断裂。Saracatinib也明显抑制Boyden小室的DU145和PC3移动。Saracatinib有效且持久抑制Akt, 且增强A549和Calu-6细胞对放射处理的敏感性。Saracatinib在活性, 再吸收, 及组成上抑制蚀骨细胞。Saracatinib也可逆阻断蚀骨细胞前体的移动。				
体内研究	Saracatinib作用于Src3T3异体移植瘤显示出强的肿瘤生长抑制率, 且Saracatinib造成Calu-6、MDA-MB-231、AsPc-1和BT474C移植瘤生长适当延迟。Saracatinib处理常位DU145鼠, 按鼠体重, 每千克每天口服处理25mg Saracatinib, 结果显示出强的抗癌活性。				
临床实验	N/A				
特征	Saracatinib是第一个作用于人类肿瘤组织Src通路的抑制剂。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	使用受体和非受体酪氨酸激酶的重组催化区, 通过酶联免疫吸附法测定酪氨酸激酶活性的IC ₅₀ 值。加入的Saracatinib剂量从0.001到10mM不等。针对丝氨酸/苏氨酸激酶的特定实验是加32P的渗透捕捉实验。在加入10μl 20mM Mg.ATP开始反应前, 包含0.5μl Saracatinib或DMSO(作对照)或pH 3.0 buffer(作对照)的多支路384孔板加入15μl酶和肽/蛋白底物温育5分钟。所有酶的最终浓度都接近米氏常数(K _m)。实验在

	室温下进行30分钟，然后加入5 μ l正磷酸终止反应。混合后，孔中的内含物加到P81联合板上，使用正磷酸作为洗涤缓冲液，然后计算IC50值。
--	--

细胞实验	
细胞系	PC3、DU145、CWR22Rv1、LNCaP、LAPC-4、PZ-HPV7和RWPE-1细胞
浓度	62.5nM-16mM
处理时间	1、3和5天
方法	PC3, DU145, CWR22Rv1, LNCaP, LAPC-4, PZ-HPV7及RWPE-1细胞按 2×10^3 密度接种在96孔板上，温育过夜。加入浓度不等(62.5nM-16mM)的Saracatinib。1、3、5天后分离培养基，每孔加入0.2ml DMSO，按每分钟200轮持续震荡96孔板15分钟。MTT实验测IC50值。

动物实验	
动物模型	移植DU145细胞的CB17鼠
配制	溶于0.5%羟丙基甲基纤维素和0.1% Tween-80中
剂量	25mg/kg
给药方式	每天口服处理

➤ 参考文献:

- 1.Chang YM. Oncogene. 2008, 27(49), 6365-6375.
- 2.Green TP, et al. Mol Oncol. 2009, 3(3), 248-261.
- 3.Purnell PR, et al. J Thorac Oncol. 2009, 4(4), 448-454.
- 4.de Vries TJ, et al. Mol Cancer Res. 2009, 7(4), 476-488.
- 5.Gwanmesia PM, et al. BMC Cancer. 2009, 13;9:53.
- 6.Hiscox S, et al. Breast Cancer Res Treat. 2009, 115(1), 57-67.
- 7.Chen Y, et al. Clin Cancer Res. 2009, 15(10), 3396-3405.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1040-10mM	Saracatinib (Src抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC1040-5mg	Saracatinib (Src抑制剂)	5mg
SC1040-25mg	Saracatinib (Src抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01