

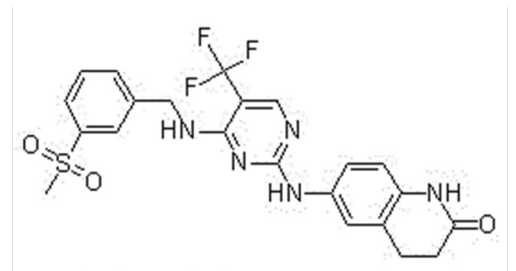
## PF573228 (FAK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1099-10mM	PF573228 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1099-5mg	PF573228 (FAK抑制剂)	5mg
SC1099-25mg	PF573228 (FAK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	6-[[4-[(3-methylsulfonylphenyl)methylamino]-5-(trifluoromethyl)pyrimidin-2-yl]amino]-3,4-dihydro-1H-quinolin-2-one
简称	PF573228
别名	PF 573228, PF-573228, PF 228, PF-228, PF 573,228, PF-573,228, PF228 cpd, PF573,228
中文名	N/A
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>5</sub> O <sub>3</sub> S
分子量	491.49
CAS号	869288-64-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 26mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.02ml DMSO, 或每4.91mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1099-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PF-573228是一种ATP竞争性的FAK抑制剂, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为4nM, 作用于FAK比作用于Pyk2、CDK1/7和GSK-3β选择性高~50到250倍。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling				
靶点	FAK	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	4nM	—	—	—	—
体外研究	PF 573228作用于REF52细胞、PC3细胞、SKOV-3细胞及L3.6p1和F-G、MDCK细胞, 抑制FAK Tyr397磷酸化, IC <sub>50</sub> 为30-500nM。然而, PF 573228(1μM)抑制80% FAK磷酸化, 却不抑制细胞生长或凋亡。PF 573228处理细胞, 抑制血清或FN-定向迁移, 且降低粘着斑转换。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 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	纯化的激活FAK激酶结构域(410-689氨基酸)与50μM ATP和每孔10μg Glu和Tyr的随机肽(摩尔比为4:1), 聚(Glu/Tyr)在激酶缓冲液(50mM HEPES(pH 7.5)、125mM NaCl、48mM MgCl <sub>2</sub> )中反应15分钟。使用按1/2-Log浓度连续稀释的化合物(起始于1μM的最高浓度)处理磷酸化的聚(Glu/Tyr)。每种浓度按一式三份进行。使用一般的抗磷酸化酪氨酸(PY20)抗体, 随后使用辣根过氧化物酶偶联的山羊抗小鼠IgG抗体检测聚(Glu/Tyr)的磷酸化。加入标准的辣根过氧化物酶底物3,3',5,5'-四甲基联苯胺(TMB), 在450nm处得到光密度读数, 随后加入终止液(2M H <sub>2</sub> SO <sub>4</sub> )。使用Hill Slope模型来测定IC <sub>50</sub> 值。

细胞实验	
细胞系	REF52或PC3细胞
浓度	~10μM
处理时间	3天
方法	REF52或PC3细胞按每孔1×10 <sup>4</sup> 接种在24孔板中, 一式三份, 24小时后, 使用指定浓度的每种抑制剂处

	理, 进行生长实验, 持续3天。随后, 收集细胞并计数。
--	------------------------------

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1.Slack-Davis JK, et al. J Biol Chem. 2007, 282(20), 14845-14852.

➤ **包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1099-10mM	PF573228 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1099-5mg	PF573228 (FAK抑制剂)	5mg
SC1099-25mg	PF573228 (FAK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

➤ **保存条件:**

-20°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°C保存, 预计6个月有效。

➤ **注意事项:**

- 本产品对人体有毒, 操作时请特别小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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