

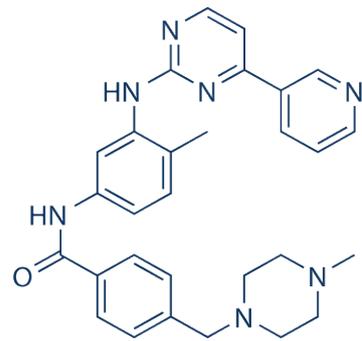
## Imatinib (PDGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0200-10mM	Imatinib (PDGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0200-5mg	Imatinib (PDGFR抑制剂)	5mg
SC0200-25mg	Imatinib (PDGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-[[4-methylpiperazin-1-yl)methyl]-N-[4-methyl-3-[(4-pyridin-3-ylpyrimidin-2-yl)amino]phenyl]benzamide
简称	Imatinib
别名	ST 1571, ST1571, STI571, STI 571, STI-571, CGP 57148, CGP-57148, CGP57148B, Gleevec, Glivec, Imatinib mesylate, Imatinib methanesulfonate
中文名	伊马替尼
化学式	C <sub>29</sub> H <sub>31</sub> N <sub>7</sub> O
分子量	493.6
CAS号	152459-95-5
纯度	99.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 14mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.01ml DMSO, 或每4.94mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0200-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Imatinib(STI571)是一种多靶点v-Abl、c-Kit和PDGFR, IC50分别为0.6、0.1和0.1μM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	PDGFR	c-Kit	v-Abl	—	—
IC50	100nM	100nM	600nM	—	—
体外研究	体外抑制一组酪氨酸和丝/苏氨酸蛋白激酶实验, 说明Imatinib有效抑制v-Abl酪氨酸激酶和PDGFR, IC50分别为0.6和0.1μM。Imatinib抑制野生型c-kit激酶活性的SLF依赖性激活, IC50约为0.1μM, 与抑制PDGFR所需的浓度相似。Imatinib抑制人类支气管类癌细胞NCI-H727和胰腺类癌细胞BON-1生长, IC50分别为32.4和32.8μM。最新研究显示Imatinib作用于慢性粒细胞白血病, 通过下调hERG1 K <sup>+</sup> 通道, 具有恢复其抗白血病效果的潜力, 而hERG1 K <sup>+</sup> 通道在白血病细胞中高表达, 且易引发白血病。				
体内研究	Imatinib作用于三种从新鲜人类小细胞肺癌衍生的移植瘤, 具有不同的抗肿瘤效果, 抑制SCLC6、SCLC61和SCLC108肿瘤生长分别达80%、40%和78%, 而对SCLC74生长没有明显抑制效果。Imatinib处理高脂肪饲料喂的ApoE(-/-)小鼠, 显著降低高脂肪诱导的脂质染色区, 按10、20和40mg/kg剂量饲喂, 与未经高脂肪饮食处理的对照组相比, 脂质染色区分别降低30%、27%和35%, 且抑制颈动脉脂质堆积。				
临床实验	N/A				
特征	Imatinib是多靶点酪氨酸激酶抑制剂。				

#### ➤ 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	从BALB/c 3T3细胞抽提物中使用兔抗血清免疫沉淀PDGF受体, 然后小鼠PDGF受体置于冰上2小时。使用蛋白A-琼脂糖磁珠, 用于收集抗原-抗体复合物。使用TNET(50mM Tris(pH7.5)、140mM NaCl、5mM EDTA、1% Triton X-100)冲洗免疫沉淀反应两次, 使用TNE(50mM Tris(pH7.5)、140mM EDTA)冲洗一次, 再使用激酶buffer(20mM Tris(pH7.5)、10mM MgCl <sub>2</sub> )冲洗一次。在4°C下使用PDGF(50ng/ml)刺激10分钟, 在反应混合物中加入不同浓度Imatinib。与10μCi[7-33P]-ATP及1μM ATP在4°C下温育10分钟, 然后测定PDGF受体激酶活性。通过SDS-PAGE在7.5%凝胶上分离免疫复合物。

细胞实验	
细胞系	BON-1和NCI-H727细胞
浓度	0-100 $\mu$ M
处理时间	48小时
方法	BON-1细胞和NCI-H727细胞按一式三份接种在平底96孔板上，分别在补充10%胎牛血清的DMEM或RPMI 1640完全培养基中粘附过夜，更换培养基为无血清培养基(阴性对照)或含连续稀释Imatinib的无血清培养基。48小时后(对照组细胞不汇合)，通过MTT实验测定代谢活性细胞数，使用Packard Spectra酶标仪在540nm处测定吸光值。按如下公式计算抑制生长率：抑制率=(1-a/b) $\times$ 100%，a和b分别为实验组和对照组的吸光值。

动物实验	
动物模型	SCLC6、SCLC61、SCLC74和SCLC108小细胞注射进Swiss小鼠(nu/nu，雌性)
配制	Imatinib在水中稀释
剂量	70或100mg/kg
给药方式	腹腔注射

### 参考文献：

1. Buchdunger E, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 1995; 92(7):2558-2562.
2. Heinrich MC, et al. Blood. 2000; 96(3):925-932.
3. Decaudin D, et al. Int J Cancer. 2005; 113(5):849-856.
4. Yao JC, et al. Clin Cancer Res. 2007; 13(1):234-240.
5. Ballinger ML, et al. J Cell Mol Med. 2010; 14(6B):1408-1418.
6. Zheng F, et al. Med Oncol. 2012; 29(3):2127-2135.

### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0200-10mM	Imatinib (PDGFR抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC0200-5mg	Imatinib (PDGFR抑制剂)	5mg
SC0200-25mg	Imatinib (PDGFR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：

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当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降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、体内研究结果或其它相关文献，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 2017.02.09