

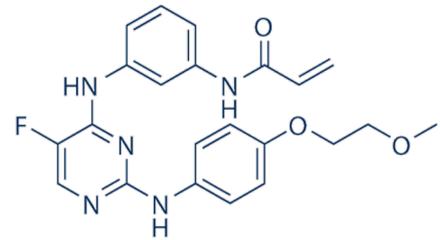
AVL292 (BTK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1139-10mM	AVL292 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1139-5mg	AVL292 (BTK抑制剂)	5mg
SC1139-25mg	AVL292 (BTK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[3-[[[5-fluoro-2-[4-(2-methoxyethoxy)anilino]pyrimidin-4-yl]amino]phenyl]prop-2-enamide
简称	AVL292
别名	CC-292, CC292, CC 292, AVL-292, AVL 292
中文名	N/A
化学式	C ₂₂ H ₂₂ FN ₃ O ₃
分子量	423.44
CAS号	1202757-89-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 85mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.18ml DMSO, 或每4.23mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1139-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	CC-292 (AVL-292)是一个通过共价结合的, 可以口服, 并且具有高度选择性的BTK抑制剂, 其IC ₅₀ 小于0.5nM, 展示了比其他被测激酶至少1400倍的选择性。Phase 1。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	BTK	YES	c-Src	BRK	Lyn
IC ₅₀	<0.5nM	723nM	1.729μM	2.43μM	4.401μM
体外研究	AVL-292在Ramos细胞中对BTK产生了剂量依赖性的抑制作用, 其EC ₅₀ 为8nM; 并且抑制了下游的BCR通路。AVL-292通过抑制BTK的活性, 进一步的抑制了B细胞的增殖, 其EC ₅₀ 为3nM。				
体内研究	在胶原蛋白诱导的小鼠关节炎模型中, AVL-292(3-30mg/kg, p.o.)剂量依赖性的抑制了这类炎症的临床症状, 包括关节和爪子的肿胀度以及受影响爪子发红症状的减少。				
临床实验	N/A				
特征	Orally bioavailable BTK-selective inhibitor that has been tested in Phase I clinical trials for treatment of relapsed or refractory B-NHL, CLL and WM.				

➤ 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	实验条件包括, 40μM ATP(1X KMATP), 10μM Y5-Sox和10nM BTK酶。简言之, 将由1.13X ATP和Y5 Sox组成的底物混合物放入由20mM Tris, pH 7.5, 5mM MgCl ₂ , 1mM EGTA, 5mM 甘油磷酸, 5%甘油和0.2mM DTT组成的1X Omnia激酶反应缓冲液中。关于IC ₅₀ 测定, 将5μl酶和以三倍比例稀释的抑制剂放入到50% DMSO中, 25°C孵育30min。激酶反应从加入45μl ATP/Y5底物混合物开始计时, 用Synergy 4 plate reader在λex360/λem485处检测60分钟。将每个小孔的反应根据GraphPad软件制作成动力学曲线从而计算出IC ₅₀ 值。

细胞实验	
细胞系	人源B细胞
浓度	~1000nM
处理时间	72 hours
方法	用负选择的方式分离天然人源B细胞并用RPMI稀释为0.4-0.5×10 ⁶ cells/ml的悬浮液。将细胞与α-human IgM(每孔终浓度5μg/ml)混合, 然后加入DMSO或者AVL-292(每孔终浓度分别为0.01、0.1、1.0、10.0、

	00.0、1000nM), 放入96孔板中。细胞在37°C, 5% CO ₂ 的培养箱中孵育56小时。然后加入3H-Thymidine(每孔终浓度1μCi), 培养过夜后检测3H含量。实验进行三次。
--	--

动物实验	
动物模型	胶原蛋白诱导的小鼠关节炎模型
配制	N/A
剂量	~30mg/kg
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

1.Evans EK, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2013, 346(2), 219-228.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1139-10mM	AVL292 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1139-5mg	AVL292 (BTK抑制剂)	5mg
SC1139-25mg	AVL292 (BTK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