



碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology
 订货热线: 400-168-3301或800-8283301
 订货e-mail: order@beyotime.com
 技术咨询: info@beyotime.com
 网址: http://www.beyotime.com

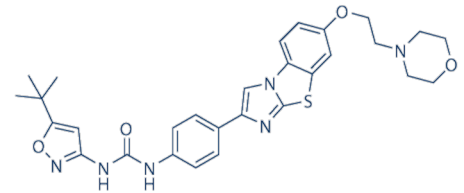
Quizartinib (FLT3抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1049-10mM	Quizartinib (FLT3抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1049-5mg	Quizartinib (FLT3抑制剂)	5mg
SC1049-25mg	Quizartinib (FLT3抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-(5-tert-butyl-1,2-oxazol-3-yl)-3-[4-[6-(2-morpholin-4-ylethoxy)imidazo[2,1-b][1,3]benzothiazol-2-yl]phenyl]urea
简称	Quizartinib
别名	AC220, AC-220, AC 220, AC010220, AC 010220
中文名	N/A
化学式	C ₂₉ H ₃₂ N ₆ O ₄ S
分子量	560.67
CAS号	950769-58-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <0.3mg/ml; DMSO 33.2mg/ml; Ethanol <0.5mg/ml
溶液配制	5mg加入0.89ml DMSO, 或每5.61mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1049-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Quizartinib (AC220)是一种二代FLT3抑制剂, 作用于Flt3(ITD/WT), 在MV4-11和RS4;11细胞中IC50分别为1.1nM/4.2nM, 作用于Flt3比作用于KIT、PDGFRA、PDGFRB、RET和CSF-1R选择性高10倍。Phase 3。				
信号通路	Angiogenesis; Protein Tyrosine Kinase				
靶点	FLT3 (ITD)	FLT3 (WT)	—	—	—
IC50	1.1nM	4.2nM	—	—	—
体外研究	AC220是最有效的FLT3选择性抑制剂, 可用于治疗急性骨髓性白血病(Aml)。AC220在生化和细胞实验中具有低纳摩尔效果和特别的激酶选择性, 抑制大部分人类蛋白激酶时具有高选择性。AC220是治疗急性骨髓性白血病(Aml)的新型FLT3抑制剂。				
体内研究	AC220作用于移植瘤模型, 具有好的药品属性, 极高的药效和耐受性。在体内, AC220作用于FLT3-ITD Aml鼠模型, 抑制FLT3活性, 明显延长寿命; 作用于依赖FLT3的移植瘤鼠模型时, 根除肿瘤; 作用于病人原代细胞时, 有效抑制FLT3活性。				
临床实验	N/A				
特征	AC220是二代FLT3抑制剂, 且作为临床FLT3抑制剂的第一候选药。				

➤ 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	为了测定AC220抑制无靶点激酶的效果, 为了比较AC220和其他FLT抑制剂的选择性, 使AC220作用于KinomeScan一组402种激酶进行结合试验, 其中80%为典型的人类蛋白激酶。测定所有激酶的解离常数。计算绝对选择性和作用于FLT的相对选择性。

细胞实验	
细胞系	MV4-11和RS4;11细胞
浓度	0-100nM
处理时间	72小时及2小时
方法	在增殖实验中, 细胞培养在低血清培养基(含0.5% FBS)中过夜, 然后按每孔4×10 ⁴ 个细胞接种在96孔板上, 然后加入AC220, 37°C下温育72小时。测定细胞活力。测定抑制FLT3自磷酸化的效果, 细胞培养在低血清培养基(含0.5% FBS)过夜, 然后按每孔4×10 ⁵ 个细胞接种在96孔板上。细胞和AC220一起在37°C下

	温育2小时，诱导 RS4;11细胞中FLT3自磷酸化，加入100ng/ml FLT3配位体，持续15分钟。转移细胞溶解物到用FLT3抗体包被的96孔板上。然后加入作用于FLT3的生物素化抗体，测定全部FLT3，或者作用于磷酸酪氨酸的抗体，测定FLT3自磷酸化。使用SULFO标记的链霉亲和素二抗进行电化学发光测定。
--	---

动物实验	
动物模型	雌性裸鼠或严重联合免疫缺陷鼠
配制	22%羟丙基-β-环糊精
剂量	10ml/kg
给药方式	口服饲喂处理

➤ **参考文献:**

1.Zarrinkar PP, et al. Blood. 2009, 114(14), 2984-2992.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1049-10mM	Quizartinib (FLT3抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1049-5mg	Quizartinib (FLT3抑制剂)	5mg
SC1049-25mg	Quizartinib (FLT3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