

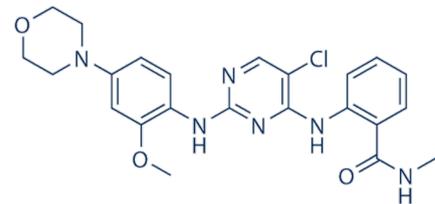
## TAE226 (FAK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1076-10mM	TAE226 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1076-5mg	TAE226 (FAK抑制剂)	5mg
SC1076-25mg	TAE226 (FAK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[[5-chloro-2-(2-methoxy-4-morpholin-4-ylanilino)pyrimidin-4-yl]amino]-N-methylbenzamide
简称	TAE226
别名	NVP-TAE226, NVP-TAE 226, NVP-TAE226, TAE-226, TAE 226
中文名	N/A
化学式	C <sub>23</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>6</sub> O <sub>3</sub>
分子量	468.94
CAS号	761437-28-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 94mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.07ml DMSO, 或每4.69mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1076-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	TAE226 (NVP-TAE226)是一种有效的FAK抑制剂, IC <sub>50</sub> 为5.5nM, 最有效作用于Pyk2, 对InsR、IGF-1R、ALK和c-Met作用效果比其弱10到100倍左右。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling				
靶点	PYK2	FAK	Insulin Receptor	IGF-1R	c-Met
IC <sub>50</sub>	3.5nM	5.5nM	43.5nM	140nM	160nM
体外研究	在血清饥饿的U87细胞中, NVP-TAE226(<1μM)抑制细胞外基质诱导的FAK(Tyr397)自身磷酸化。U87和U251细胞中, NVP-TAE226(<1μM)也会抑制IGF-I-诱导的IGF-1R磷酸化和其下游靶点基因, 比如MAPK和Akt的活性。U87和U251细胞中, NVP-TAE226(<10μM)阻碍肿瘤细胞生长, 并减弱G(2)-M细胞周期进程, 其与细胞周期素B1和磷酸化cdc2 (Tyr15)蛋白质表达的减少相关。在体外胶质瘤细胞系人工基底膜侵袭实验中, 与对照组相比, NVP-TAE226(1μM)抑制至少50%的肿瘤细胞侵袭。根据caspase-3/7活化和poly(ADP-ribose)聚合酶裂解以及膜联蛋白V凋亡试验, NVP-TAE226(1μM)治疗对胶质瘤细胞系, 包括野生型p53, 仅表现出G(2)-M期阻滞, 而负荷突变体p53的胶质瘤细胞会发生细胞凋亡。在人成神经细胞瘤细胞系SK-N-AS中, NVP-TAE226(5μM)抑制FAK磷酸化。NVP-TAE226(<10μM)对人成神经细胞瘤细胞系SK-N-AS的治疗导致细胞活性降低, 细胞周期阻滞, 以及细胞凋亡增加。NVP-TAE226(0.1μM-10μM)抑制HMEC1细胞的微管形成。				
体内研究	NVP-TAE226(75mg/kg)显著增加负荷颅内胶质瘤异种移植物的小鼠的存活率。在人结肠癌SCID 小鼠模型中, NVP-TAE226(100mg/kg, 口服)显著降低微血管密度。在体内模型中, NVP-TAE226(100mg/kg, 口服)有效抑制MIA PaCa-2人胰腺肿瘤生长, 而不引起体重损失。在体内模型中, NVP-TAE226剂量依赖性抑制4T1小鼠乳腺癌生长和肺转移, 与Y397上FAK的自身磷酸化和丝氨酸473上Akt磷酸化的抑制相关。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	U87和U251细胞系
浓度	10 $\mu$ M
处理时间	5天
方法	细胞培养物用0.05%胰蛋白酶采集，并重复三份以2 $\times$ 10 <sup>4</sup> 接种在24孔培养板，24小时后用药物处理。培养基用于模拟处理。处理后，在指定当天采集细胞，活细胞使用Vi-细胞活性分析计数。

动物实验	
动物模型	负荷颅内胶质瘤异种移植物的雄性裸鼠
配制	0.5%甲基纤维素
剂量	75mg/kg
给药方式	通过口服给药

➤ **参考文献:**

- 1.Liu TJ, et al. Mol Cancer Ther. 2007, 6(4), 1357-1367.
- 2.Beierle EA, et al. Cancer Invest, 2008, 26(2), 145-151.
- 3.Schultze A, et al. Invest New Drugs. 2010, 28(6), 825-833.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1076-10mM	TAE226 (FAK抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC1076-5mg	TAE226 (FAK抑制剂)	5mg
SC1076-25mg	TAE226 (FAK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:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，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成高浓度的储备液(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