

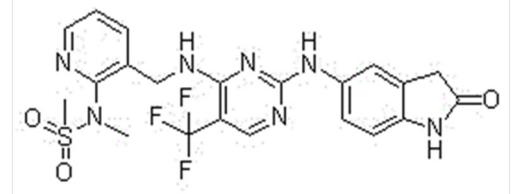
## PF562271 (FAK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1094-10mM	PF562271 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1094-5mg	PF562271 (FAK抑制剂)	5mg
SC1094-25mg	PF562271 (FAK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-methyl-N-[3-[[[2-[(2-oxo-1,3-dihydroindol-5-yl)amino]-5-(trifluoromethyl)pyrimidin-4-yl]amino]methyl]pyridin-2-yl]methanesulfonamide
简称	PF562271
别名	PF-00562271, PF 00562271
中文名	N/A
化学式	C <sub>21</sub> H <sub>20</sub> F <sub>3</sub> N <sub>7</sub> O <sub>3</sub> S
分子量	507.49
CAS号	717907-75-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.99ml DMSO, 或每5.07mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1094-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PF-562271是一种有效的, ATP竞争性的, 可逆的FAK抑制剂, 无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为1.5nM, 作用于FAK比作用于Pyk2选择性高10倍左右, 比作用于其他蛋白激酶(除了一些CDKs)选择性高100倍以上。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling				
靶点	FAK	PYK2	CDK2/CyclinE	CDK3/CyclinE	CDK1/CyclinB
IC <sub>50</sub>	1.5nM	13nM	30nM	47nM	47nM
体外研究	PF-562271会结合到ATP与FAK结合的部位, 在激酶铰链区形成抑制剂与主链原子之间的两种氢键。PF-562271在测量FAK磷酸化可诱导的基于细胞的分析中效果很好, IC <sub>50</sub> 为5nM。PF-562271(3.3μM)导致PC3-M细胞周期停滞在G1期。在鸡胚绒毛尿囊膜实验中PF-562271(1nM)阻断bFGF刺激的血管生成。PF-262271强有效的阻断血管生长但对血管渗漏没有明显影响。PF-562271(250nM)可以完全抑制整体A431细胞侵入胶原蛋白中。				
体内研究	在携带U87MG的小鼠中PF-562271(<33mg/kg口服)抑制肿瘤中FAK磷酸化并具有时间和剂量依赖特性。PF-562271(50mg/kg, 口服, 一天两次)对BxPc3异种移植小鼠中肿瘤生长抑制率为86%, 对PC3-M异种移植小鼠中肿瘤生长抑制率为45%。PF-562271(25mg/kg, 一天两次)处理的携带H125肺部异种移植肿瘤凋亡率提高2倍。PF-562271(33mg/kg, 口服)24小时后抑制小鼠中肿瘤细胞的广泛运动。PF-562271(33mg/kg, 口服)导致小鼠中E-cadherin动力学的改变, 这与减弱的E-cadherin依赖的整体细胞运动有关。在皮下局部异种移植PC3M-luc-C6的小鼠模型中PF-562271(25mg/kg, 口服, 一天两次)导致肿瘤生长率62%的抑制。在胫骨植入MDA-MB-231细胞的大鼠中PF-562271(5mg/kg, 口服)导致骨钙素和松质骨参数显著而相似的增加同时导致肿瘤生长速度和骨愈合信号的下降。				
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	纯化的活性FAK激酶区域(410-689氨基酸)与50μM ATP和每孔10μg随机Glu和Tyr聚合物多肽p(Glu/Tyr)反应15分钟, 体系为激酶缓冲液, 包含[50mM HEPES(pH 7.5)、125mM NaCl和48mM MgCl <sub>2</sub> ]。p(Glu/Tyr)的磷酸化受到连续稀释化合物的干扰, 化合物浓度从最高1μM开始加入不同1/2-Log浓度。每个浓度重复检测三次。p(Glu/Tyr)的磷酸化用通用的抗酪氨酸磷酸化抗体(PY20)和(HRP)偶联的羊抗鼠IgG抗体检

测。加入HRP底物,加入终止液(2mol/L H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub>)后测量450nm处吸光度。利用Hill-Slope模型计算IC50值。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	携带BxPc3或PC3-M异种移植的无胸腺雌性小鼠
配制	5% Gelucire
剂量	50mg/kg
给药方式	填喂给药

➤ **参考文献:**

- 1.Roberts WG, et al. Cancer Res. 2008, 68(6), 1935-1944.
- 2.Lim ST, et al. Cell Cycle. 2008, 7(15), 2306-2314.
- 3.Canel M, et al. Cancer Res. 2010, 70(22), 9413-9422.
- 4.Sun H, et al. Cancer Biol Ther. 2010, 10(1), 38-43.
- 5.Bagi CM, et al. Cancer. 2008, 112(10), 2313-2321.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1094-10mM	PF562271 (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1094-5mg	PF562271 (FAK抑制剂)	5mg
SC1094-25mg	PF562271 (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