



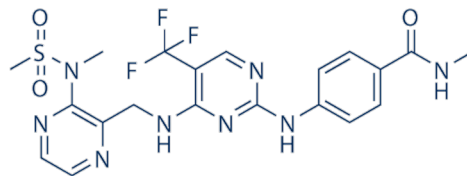
## Defactinib (FAK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1157-10mM	Defactinib (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1157-5mg	Defactinib (FAK抑制剂)	5mg
SC1157-25mg	Defactinib (FAK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-methyl-4-[[4-[[3-[methyl(methylsulfonyl)amino]pyrazin-2-yl]methylamino]-5-(trifluoromethyl)pyrimidin-2-yl]amino]benzamide
简称	Defactinib
别名	PF-04554878, PF04554878, PF 04554878, VS-6063, VS 6063, VS6063
中文名	N/A
化学式	C <sub>20</sub> H <sub>21</sub> F <sub>3</sub> N <sub>8</sub> O <sub>3</sub> S
分子量	510.49
CAS号	1073154-85-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 5mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.98ml DMSO, 或每5.10mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1157-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Defactinib (VS-6063, PF-04554878)是一种选择性, 且口服有效的FAK抑制剂。Phase 2。				
信号通路	Angiogenesis; Cytoskeletal Signaling				
靶点	FAK	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	在紫杉醇敏感的(SKOV3ip1)和紫杉醇耐药的(SKOV3-TR)细胞系中, VS-6063显著抑制pFAK (Tyr397)表达。VS-6063和紫杉醇结合协同减少增殖, 增加SKOV3ip1、SKOV3-TR、HeyA8和HeyA8-MDR细胞的凋亡。VS-6063和Y15结合协同降低甲状腺癌细胞系的生存能力, 集落形成和细胞黏附。				
体内研究	在PTX敏感和PTX耐药模型中, VS-6063(50mg/kg p.o.)与紫杉醇合用增强生长抑制作用。				
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	SKOV3ip1、SKOV3-TR、HeyA8和HeyA8-MDR细胞
浓度	~10μM
处理时间	96小时
方法	卵巢癌细胞用逐渐增加浓度的VS-6063处理96小时, 然后进行MTT测定。结果通过重复三次实验证实。

动物实验	
动物模型	负荷SKOV3ip1, SKOV3-TR, HeyA8或HeyA8-MDR肿瘤的小鼠
配制	PBS
剂量	50mg/kg

给药方式	p.o.
------	------

➤ **参考文献:**

- 1.Kang Y, et al. J Natl Cancer Inst. 2013, 105(19), 1485-1495.
- 2.O'Brien S, et al. Oncotarget. 2014, 5(17), 7945-7959.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1157-10mM	Defactinib (FAK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1157-5mg	Defactinib (FAK抑制剂)	5mg
SC1157-25mg	Defactinib (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