



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **BMS-2; MET kinase-IN-4 ; 1-(4-氟苯基)-N-[3-氟-4-(1H-吡咯并[2,3-B]吡啶-4-基氧基)苯基]-1,2-二氢-2-氧代-3-吡啶甲酰胺**

CAS 号: **888719-03-7**

产品货号: **S87884**

生物活性:

生物活性:					
Description		MET kinase-IN-4 是一种 Met 激酶抑制剂, 具有口服活性。MET kinase-IN-4 具有有效的 Met 激酶抑制活性, IC50 值为 1.9 nM。MET kinase-IN-4 可用于癌症研究。			
IC50 & Target		IC50: 1.9 nM (Met); 4 nM (Flt-3); 27 nM (VEGFR-2)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	GTL 16 cell line	IC50	60 nM	Antiproliferative activity against Met-dependent human GTL16 cells after 72 hrs by MTS assay	
	GTL 16 cell line	IC50	60 nM	Antiproliferative activity against human GTL16 cells after 72 hrs by MTS assay	
	NCI-N87	IC50	> 5000 nM	Antiproliferative activity against human N87 cells after 72 hrs by MTS assay	
In Vitro		MET kinase-IN-4 (Compound 2) 具有有效的 Met 激酶抑制活性, IC50 值为 1.9 nM[1]。 MET kinase-IN-4 抑制 Flt-3 和 VEGFR-2 激酶, IC50 值分别为 4 和 27 nM[1]。 MET kinase-IN-4 (3 μM) 在人和小鼠肝微粒体中表现出良好的代谢稳定性[1]。			
In Vivo	MET kinase-IN-4 (Compound 2) 在小鼠体内具有良好的药代动力学特征[1]。 MET kinase-IN-4 在 GTL-16 人胃癌异种移植模型中表现出显著的体内抗肿瘤活性[1]。				
	Animal Model:		Mice[1]		
	Dosage:		5, 10 mg/kg		
	Administration:		IV, PO		
	Result:		Showed extensive extravascular distribution and a favorable half-life.		
	Animal Model:		Nude mice[1]		
	Dosage:		6.25, 12.5, 25 and 50 mg/kg		
	Administration:		PO, once a day		
Result:		Showed antitumor activity in dose-dependet.			
Solvent&Solubility		细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (218.14 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
Preparing Stock Solutions		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1814 mL	10.9070 mL	21.8141 mL
		5 mM	0.4363 mL	2.1814 mL	4.3628 mL
		10 mM	0.2181 mL	1.0907 mL	2.1814 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。					



	以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.45 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Kyoung Soon Kim, et al. Discovery of pyrrolopyridine-pyridone based inhibitors of Met kinase: synthesis, X-ray crystallographic analysis, and biological activities. J Med Chem. 2008 Sep 11;51(17):5330-41.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1814 mL	10.9070 mL	21.8141 mL	54.5351 mL
	5 mM	0.4363 mL	2.1814 mL	4.3628 mL	10.9070 mL
	10 mM	0.2181 mL	1.0907 mL	2.1814 mL	5.4535 mL
	15 mM	0.1454 mL	0.7271 mL	1.4543 mL	3.6357 mL
	20 mM	0.1091 mL	0.5454 mL	1.0907 mL	2.7268 mL
	25 mM	0.0873 mL	0.4363 mL	0.8726 mL	2.1814 mL
	30 mM	0.0727 mL	0.3636 mL	0.7271 mL	1.8178 mL
	40 mM	0.0545 mL	0.2727 mL	0.5454 mL	1.3634 mL
	50 mM	0.0436 mL	0.2181 mL	0.4363 mL	1.0907 mL
	60 mM	0.0364 mL	0.1818 mL	0.3636 mL	0.9089 mL
	80 mM	0.0273 mL	0.1363 mL	0.2727 mL	0.6817 mL
	100 mM	0.0218 mL	0.1091 mL	0.2181 mL	0.5454 mL