

产品名称：**5-氯-N2-[4-[4-(二甲基氨基)-1-哌啶基]-2-甲氧基苯基]-N4-[2-(二甲基亚磷酰)苯基]-2,4-嘧啶二胺**

产品别名：**ALK-IN-1 ； AP26113; Brigatinib analog**

生物活性:					
Description	ALK-IN-1 (Brigatinib analog) is a potent and selective active inhibitor of anaplastic lymphoma kinase(ALK), Patent US20140066406 A1.				
Solvent&Solubility	<i>In Vitro:</i>				
	DMSO : 50 mg/mL (94.52 mM; Need ultrasonic)				
		<div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	1.8903 mL	9.4516 mL	18.9032 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3781 mL	1.8903 mL	3.7806 mL
		10 mM	0.1890 mL	0.9452 mL	1.8903 mL
	<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限: -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用， -20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。</p> <p><i>In Vivo:</i></p> <p>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：</p> <p>——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</p> <p>1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。</p> <p>2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>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 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。</p> <p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.73 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>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。</p>				
	[1]. <u>Sen Zhang, Frank Wang, Jeffrey Keats, Abstract LB-298: AP26113, a potent ALK inhibitor, overcomes mutations in EML4-ALK that confer resistance to PF-02341066 (PF1066). Cancer Research: April 15,</u>				

References

2010: Volume 70, Issue 8, Supplement 1

[2]. Victor M. Rivera, Frank Wang, Rana Anjum, Abstract 1794: AP26113 is a dual ALK/EGFR inhibitor: Characterization against EGFR T790M in cell and mouse models of NSCLC. Cancer Research: April 15,

2012: Volume 72, Issue 8, Supplement 1



源叶生物