



碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology  
 订货热线: 400-168-3301或800-8283301  
 订货e-mail: order@beyotime.com  
 技术咨询: info@beyotime.com  
 网址: http://www.beyotime.com

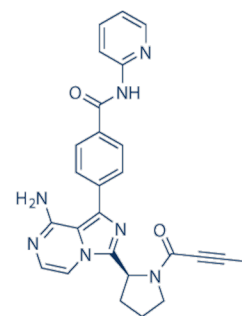
## ACP-196 (BTK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1072-10mM	ACP-196 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1072-5mg	ACP-196 (BTK抑制剂)	5mg
SC1072-25mg	ACP-196 (BTK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-[8-amino-3-[(2S)-1-but-2-ynoylpyrrolidin-2-yl]imidazo[1,5-a]pyrazin-1-yl]-N-pyridin-2-ylbenzamide
简称	ACP-196
别名	Acalabrutinib
中文名	N/A
化学式	C <sub>26</sub> H <sub>23</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>
分子量	465.51
CAS号	1420477-60-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 93mg/ml; Ethanol 93mg/ml
溶液配制	5mg加入1.07ml DMSO, 或每4.66mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1072-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Acalabrutinib is a selective second-generation Bruton's tyrosine kinase (BTK) inhibitor, which prevents the activation of the B-cell antigen receptor (BCR) signaling pathway.				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	BTK	—	—	—	—
IC50	3nM	—	—	—	—
体外研究	In the in vitro signaling assay on primary human CLL cells, acalabrutinib inhibits tyrosine phosphorylation of downstream targets of ERK, IKB, and AKT. Acalabrutinib demonstrates higher selectivity for BTK with IC50 determinations on nine kinases with a cysteine residue in the same position as BTK. Importantly, unlike ibrutinib, acalabrutinib does not inhibit EGFR, ITK, or TEC. acalabrutinib has no effect on EGFR phosphorylation on tyrosine residues Y1068 and Y1173. Compared with ibrutinib, acalabrutinib has much higher IC50 (>1000nM) or virtually no inhibition on kinase activities of ITK, EGFR, ERBB2, ERBB4, JAK3, BLK, FGR, FYN, HCK, LCK, LYN, SRC, and YES1.				
体内研究	oral administration of ACP-196 in mice results in dose-dependent inhibition of anti-IgM-induced CD86 expression in CD19 <sup>+</sup> splenocytes with an ED50 of 0.34mg/kg compared to 0.91mg/kg for ibrutinib. A similar model is used to compare the duration of Btk inhibition after a single oral dose of 25mg/kg. ACP-196 inhibits CD86 expression >90% at 3h postdose.				
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	primary human CLL cells, T cells, NK cells and epithelial cells
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	canine model of B cell NHL
配制	N/A
剂量	2.5, 5, 10mg/kg.
给药方式	orally administered

➤ **参考文献:**

1. Byrd JC, et al. J Hematol Oncol. 2016, 374(4):323-32.
2. Wu J, et al. J Hematol Oncol. 2016, 9:21.
3. Heather L. Gardner, et al. Cancer Res. 2014, 74(19 Supplement), 1744.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1072-10mM	ACP-196 (BTK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1072-5mg	ACP-196 (BTK抑制剂)	5mg
SC1072-25mg	ACP-196 (BTK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:**

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，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