

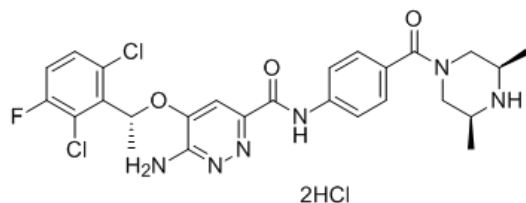
Ensartinib (ALK/MET抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5458-10mM	Ensartinib (ALK/MET 抑制剂)	10mM
SF5458-5mg	Ensartinib (ALK/MET 抑制剂)	5mg
SF5458-25mg	Ensartinib (ALK/MET 抑制剂)	25mg
SF5458-100mg	Ensartinib (ALK/MET 抑制剂)	100mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(R)-6-amino-5-(1-(2,6-dichloro-3-fluorophenyl)ethoxy)-N-(4-(4-methylpiperazine-1-carbonyl)phenyl)pyridazine-3-carboxamide, dihydrochloride
简称	Ensartinib hydrochloride
别名	X-396 hydrochloride
中文名	恩沙替尼二盐酸盐
化学式	C ₂₆ H ₂₇ Cl ₂ FN ₆ O ₃ ·2HCl
分子量	634.36
CAS号	2137030-98-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <5mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.788ml DMSO, 或者每6.34mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。



➤ 生物信息

产品描述	Ensartinib hydrochloride (X-396 hydrochloride)是一种新型的、有效的、特异的ALK/MET双酪氨酸激酶小分子抑制剂, 对ALK的IC ₅₀ 小于0.4nM, 对MET的IC ₅₀ 约为0.74nM (Ambit assays)。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase				
靶点	ALK	MET	-	-	-
IC50	<0.4nM	0.74nM	-	-	-
体外研究	Ensartinib对MET、Abl、Axl、EPHA2、LTK、ROS1和SLK也有活性作用。Ensartinib (X-396)可显著地减少ALK的自我磷酸化, 抑制野生型融合ALK的自我磷酸化需要更高的浓度。				
体内研究	X-396具有有效的抗肿瘤活性, 具有良好的药代动力学和毒理特性。X-396在体内具有良好的(大量的)生物利用度、中等的半衰期。它能显著地延迟肿瘤的生长。X-396对ALK融合阳性的脑转移具有有效的活性作用。在ALK TKI-naïve和crizotinib耐受性的ALK重排NSCLC模型中, X-396具有显著的临床水平的抗肿瘤活性。				
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	H3122和H2228肺癌细胞, SUDHL-1淋巴细胞, SY5Y神经母细胞瘤细胞
浓度	10, 100, 1000 nM
处理时间	72小时
方法	用ALK抑制剂或vehicle处理细胞, 处理72小时。然后用cell titer blue assay对细胞生长抑制进行测定。

动物实验	
动物模型	裸鼠

配制	0.5% HPMC, 0.4% Tween80, 99.1% DI water
剂量	25 mg/kg
给药方式	oral gavage

➤ 参考文献

1. Lovly CM, et al. Cancer Res. 2011, 71(14):4920-31.
2. Ticiana Leal, et al. poster presented at IASLC 7th Latin American Lung Cancer Conference.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5458-10mM	Ensartinib (ALK/MET抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5458-5mg	Ensartinib (ALK/MET抑制剂)	5mg
SF5458-25mg	Ensartinib (ALK/MET抑制剂)	25mg
SF5458-100mg	Ensartinib (ALK/MET抑制剂)	100mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg、25mg和100mg包装也可室温保存, 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个月内有效。

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降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、体内研究结果或其它相关文献, 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的等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.07.22