

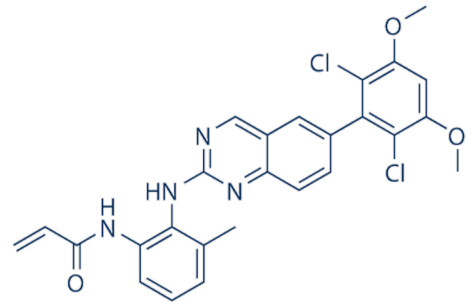
BLU-9931 (FGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1216-10mM	BLU-9931 (FGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1216-5mg	BLU-9931 (FGFR抑制剂)	5mg
SC1216-25mg	BLU-9931 (FGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[2-[[[6-(2,6-dichloro-3,5-dimethoxyphenyl)quinazolin-2-yl]amino]-3-methylphenyl]prop-2-enamide
简称	BLU-9931
别名	BLU9931, BLU 9931
中文名	N/A
化学式	C ₂₆ H ₂₂ Cl ₂ N ₄ O ₃
分子量	509.38
CAS号	1538604-68-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 6mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.98ml DMSO, 或每5.09mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1216-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	BLU9931是一种有效的, 选择性的, 且不可逆的FGFR4抑制剂, IC ₅₀ 为3nM, 选择性比作用于FGFR1/2/3分别高297、184和50倍。				
信号通路	Angiogenesis; Protein Tyrosine Kinase				
靶点	FGFR4	FGFR3	FGFR2	FGFR1	—
IC ₅₀	3nM	150nM	493nM	591nM	—
体外研究	在MDA-MB-453细胞中, BLU9931有效抑制FGFR4信号通路的磷酸化作用。BLU9931抑制HCC细胞系的增殖, 比如Hep 3B、HUH-7和JHH-7细胞系, 其表达完整的FGFR4信号复合物, EC ₅₀ <1μM。在具有完整FGFR4信号通路的PDX衍生细胞系中, BLU9931也会抑制其增殖。				
体内研究	在负荷FGF19-扩增的Hep 3B肝脏肿瘤的小鼠中, BLU9931(300mg/kg, p.o.)导致肿瘤退化, 并防止肿瘤诱导的体重损失。在负荷FGF19-过表达的PDX-衍生的LIXC012异种移植物的老鼠中, BLU9931(300mg/kg, p.o.)治疗也会导致肿瘤退化。				
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	FGFR激酶抑制试验在ATP的KM下进行。皮摩尔至纳摩尔浓度的FGFR蛋白质与1μM CSKtide, 50-250μM ATP在1X 激酶反应缓冲液(KRB)中, 一定剂量浓度系列抑制剂存在或不存在下, 于25°C培育90分钟。所有反应通过加入终止缓冲液停止, 板在Caliper EZReader2上读取数据。IC ₅₀ 值用四参数log[抑制剂]对响应模式拟合, Hill斜率不固定。

细胞实验	
细胞系	Hep 3B、HUH-7、JHH-7、PLC/PRF/5、SK-HEP-1、SNU-182、SNU-387、SNU-398、SNU-423、SNU-449、SNU-878细胞
浓度	~10μM
处理时间	72-120小时
方法	已获得的PDX-衍生的HCC细胞系接种到96孔板各自的生长培养基, 使其附着过夜, 并用稀释系列的测试化合物处理两个细胞倍增时间。细胞活性通过CellTiter-Glo测定, 结果表示为减去背景的相对光度单

	位，归一化为DMSO处理的对照组。相对EC50值以剂量反应曲线的顶部和底部平台之间50%的抑制测定。
--	--

动物实验	
动物模型	负荷LIXC012肿瘤的小鼠
配制	0.5%羧甲基纤维素/1% Tween 80作为悬浮液
剂量	~300mg/kg
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

1.Hagel M, et al. Cancer Discov. 2015, 5(4), 424-437.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1216-10mM	BLU-9931 (FGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1216-5mg	BLU-9931 (FGFR抑制剂)	5mg
SC1216-25mg	BLU-9931 (FGFR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:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当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成高浓度的储备液(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