

HB220113

PF-562271 (PF562271)

产品信息

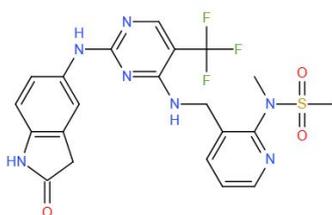
产品名称	产品编号	规格
PF-562271 (PF562271)	52607ES08	5 mg
	52607ES10	10 mg

产品描述

PF-562271 (PF-00562271; PF00562271; PF 00562271; PF 562271) 是一种可口服有效利用、ATP 竞争型的、高效可逆的 FAK (粘着斑激酶) 抑制剂, 其 IC₅₀ 值为 1.5 nM, 作用于 FAK 比作用于 Pyk2 (IC₅₀: 13 nM) 选择性高 10 倍左右, 具有潜在的抗肿瘤和抗血管生成活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	N-Methyl-N-[3-[[[2-[(2-oxo-2,3-dihydro-1H-indol-5-yl)amino]-5-trifluoromethylpyrimidin-4-yl]amino]methyl]pyridin-2-yl]methanesulfonamide; PF562271; PF 562271
中文名称 (Chinese Name)	N-甲基-N-[3-[[[2-(2-氧代-2,3-二氢-1H-吲哚-5-基)氨基]-5-三氟甲基嘧啶-4-基]氨基]甲基]吡啶-2-基]甲磺酰胺
靶点 (Target)	FAK; PYK2; CDK2/CyclinE
CAS 号 (CAS NO.)	717907-75-0
分子式 (Formula)	C ₂₁ H ₂₀ F ₃ N ₇ O ₃ S
分子量 (Molecular Weight)	507.49
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

PF-562271 (1.1 μ M, 3.3 μ M; 48 h) 作用于 PC3-M 细胞，结果显示 48 h 后 3.3 μ M 浓度的 PF-562271 改变 PC3-M 细胞的细胞周期进程，PF-562271 (3.3 μ M) 导致 PC3-M 细胞周期停滞在 G1 期。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

PF-562271 (3.3 mg/kg, 10 mg/kg, 33 mg/kg; 口服给药) 处理移植 U87MG 人成胶质细胞瘤细胞的裸鼠，结果显示在携带 U87MG 的裸鼠中，PF-562271 呈剂量和时间依赖性地抑制 FAK 磷酸化。PF-562271 (33 mg/kg) 作用 1 h，最大的 pFAK 抑制达 78%。PF-562271 (50 mg/kg; 口服给药; 一天两次) 对 BxPc3 异种移植小鼠中肿瘤生长抑制率为 86%，对 PC3-M 异种移植小鼠中肿瘤生长抑制率为 45%。^[1]在皮下局部异种移植 PC3M-luc-C6 的小鼠中，PF-562271 (25 mg/kg; 口服给药; 一天两次) 对肿瘤生长达到 62%抑制率。^[2]

参考文献

- [1]. Roberts WG, et al. Antitumor activity and pharmacology of a selective focal adhesion kinase inhibitor, PF-562,271. *Cancer Res.* 2008 Mar 15;68(6):1935-44.
- [2]. Sun H, et al. Bioluminescent imaging study: FAK inhibitor, PF-562,271, preclinical study in PC3M-luc-C6 local implant and metastasis xenograft models. *Cancer Biol Ther.* 2010 Jul 1;10(1):38-43.