

盐酸埃罗替尼 ; Erlotinib hcl

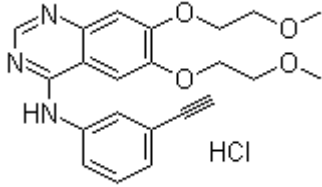
产品编号 : MB1096

质量标准 : >98.5%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 100MG;1G;5G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

分子式	C22H23N3O4·HCl	结 构 式	
分子量	429.90		
CAS No.	183319-69-9		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 4 mg/mL warmed (9.3 mM) 微溶于甲醇 几乎不溶于乙醇、乙腈, 丙酮, 乙酸乙酯和正己烷 本品在水中溶解度呈 pH 依赖性, 在 pH 小于 5 时由于仲胺的质子化作用溶解度增加; 在 pH 约 2 时, 最大溶解度约 0.4 mg/mL。		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

熔点 :223-225°C

溶解性 :DMSO 4 mg/mL warmed ; 微溶于甲醇 ;

.....几乎不溶于乙醇、乙腈, 丙酮, 乙酸乙酯和正己烷。

.....本品在水中溶解度呈 pH 依赖性, 在 pH 小于 5 时由于仲胺的质子化作用溶解度增加 ;

.....在 pH 约 2 时, 最大溶解度约 0.4 mg/mL。

干燥失重 :≤1.0%

含量 :≥99.0%

生物活性

产品描述	Erlotinib HCl (OSI-744)是一种 EGFR 抑制剂, 在无细胞试验中 IC50 为 2 nM, 对 EGFR 的选择性比对人 c-Src 或 v-Abl 高 1000 多倍。
靶点	HER1/EGFR (Cell-free assay) 2 nM
体外研究	Erlotinib 作用于 HNS 人头部和颈部肿瘤细胞, 有效抑制 EGFR 自磷酸化, HNS 人头部和颈部肿瘤细胞是表达高水平 EGFR 的细胞系。Erlotinib 对 SBC-5 细胞增殖没有作用效果。相反, Erlotinib 显著抑制 PC-9 细胞增殖, 这种作用存在剂量依赖性, PC-9 细胞在 EGFR 基因第 19 外显子含缺失突变。Erlotinib 处理也不会影响 SBC-5 细胞迁移。Erlotinib 抑制 HPAC 细胞和 Capan-1 细胞生长, IC50 分别为 1.1 和 3μM。10 uM Erlotinib 抑制 EGFR 在 Y845 (Src 依赖性磷酸化) 和 Y1068(自磷酸化)位点磷酸化。Erlotinib 只有作用于最敏感的细胞株时,

	抑制细胞外信号调节激酶, Akt, 和 S6。
体内研究	Erlotinib 单独作用于 H460a 肿瘤模型, 抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 与药物的循环水平相关。

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。埃罗替尼的临床抗肿瘤作用机制特征未完全了解。埃罗替尼抑制伴表皮生长因子受体(EGFR)酪氨酸激酶的细胞内磷酸化。关于其它酪氨酸激酶受体抑制作用的特异性特征尚未完全了解。正常细胞和癌细胞的细胞表面表达 EGFR。。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3261 mL	11.6306 mL	23.2612 mL
5 mM	0.4652 mL	2.3261 mL	4.6522 mL
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>激酶实验:</p> <p>每孔使用 100 μL 溶于 PBS 的 0.25 mg/mL PGT 对 96 孔板包被, 然后在 37$^{\circ}$C 温育过夜。吸取移除过量 PGT, 使用冲洗 buffer (0.1% Tween-20, 溶于 PBS)清洗实验板 3 次。在 50 μL 50 mM HEPES (pH 7.3), 含 125 mM NaCl, 24 mM MgCl₂, 0.1 mM 原钒酸钠, 20 μM ATP, 1.6 μg/mL EGF, 以及从 A431 细胞膜上亲和纯化的 15 ng EGFR 的混合物中进行激酶反应。加入溶于 DMSO 的 Erlotinib, DMSO 终浓度为 2.5%。加入 ATP, 开始磷酸化, 在室温下进行 8 分钟, 且持续震荡。加入吸取的反应混合物, 激酶反应终止, 使用冲洗 buffer 冲洗 4 次。磷酸化的 PGT 与 50 μL 每孔 HRP 联合的 PY54 抗磷酸抗体[在封闭液(3% BSA 和 0.05% Tween-20, 溶于 PBS)中稀释到 0.2 μg/mL]温育 25 分钟后, 测量磷酸化的 PGT。吸取移除抗体 使用冲洗 buffer 冲洗实验板 4 次。加入 TMB 微孔过氧化物酶底物 每孔 50μL, 进行比色分析, 然后加入 0.09 M 硫酸, 每孔 50 μL, 终止反应。在 450 nm 处测定吸光值而测定磷酸化。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: HPAC 细胞系和 Capan-1 细胞</p> <p>Concentrations: 0.01 μM-10 μM</p> <p>Incubation Time: 4 天或 6 天</p> <p>Method: 为了测评对细胞增殖的抑制作用, 进行 MTT 实验。细胞在 96 孔板上在 37$^{\circ}$C 下预温育, 单独加入 Erlotinib 和 Gemcitabine, 或者联合加入。在 37$^{\circ}$C 下处理 4 天(HPAC 细胞)或 6 天(Capan-1 细胞)后, 每孔加入 10 mL MTT, 然后在 37$^{\circ}$C 下温育 2-5 小时。使用 Benchmark Plus 酶标仪在 450 和 600 nm 处测定每孔的光密度。每组每种药物实验独立重复进行 2 次或 3 次。按如下计算细胞增殖抑制百分数: [(药物处理孔中的平均吸光值-无细胞孔中平均吸光值)/(对照组孔中平均吸光值-无细胞孔中平均吸光值)] \times 100。 (Only for Reference)</p>
动物实验:	<p>Animal Models: 携带 HPAC 细胞的雄性 5 周大的 BALB-nu/nu 小鼠</p> <p>Formulation: 6% Captisol</p>

	Dosages: 50 mg/kg Administration: 口服处理
--	---

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

部分客户使用美仑产品发表文献举例

- An LC-MS/MS method for the quantitation of cabozantinib in rat plasma: Application to a pharmacokinetic study.

活性化合物操作注意事项

1 产品分类：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。