

吉非替尼 ; ZD1839 ; Gefitinib

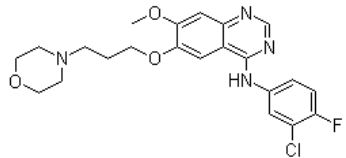
产品编号 : MB1112

质量标准 : >99%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 100MG;1G;5G

产品形式 : 白色或者类白色粉末

基本信息

分子式	C ₂₂ H ₂₄ ClFN ₄ O ₃	结构式	
分子量	446.90		
CAS No.	184475-35-2		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO > 50 mg/mL Ethanol 4 mg/mL		
	在 pH=7 时候吉非替尼几乎不溶于水溶液 在 pH=1 时候微溶于水溶液		
	溶于吡啶; 部分溶于四氢呋喃; 微溶于甲醇、乙醇、乙酸乙酯、异丙醇、乙腈		
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 :白色或者类白色粉末

熔点 :194°C ~ 198°C

溶解性 :在 pH=7 时候吉非替尼几乎不溶于水溶液, 在 pH=1 时候微溶于水溶液 ;

.....溶于二甲基亚砷 (DMSO > 50MG/ML); 溶于吡啶 ;

.....部分溶于四氢呋喃; 微溶于甲醇、乙醇、乙酸乙酯、异丙醇、乙腈

密度 :~1.3 g/cm³ (预测)

干燥失重 :≤1.0%

含量 :≥99%

生物活性

产品描述	Gefitinib (ZD1839)是一种 EGFR 抑制剂, 作用于 NR6wtEGFR 和 NR6W 细胞中的 Tyr1173, Tyr992, Tyr1173 和 Tyr992, IC50 分别为 37 nM, 37nM, 26 nM 和 57 nM。			
特性	Gefitinib 是有效的 EGFR 酪氨酸激酶抑制剂。			
靶点	Tyr1173 (NR6W cells)	Tyr1173 (NR6wtEGFR cells)	Tyr992 (NR6wtEGFR cells)	Tyr992 (NR6W cells)
	26 nM	37 nM	37 nM	57 nM
体外研究	Gefitinib 作用于高和低表达 EGFR 的细胞系, 包括 NR6, NR6M 和 NR6W 细胞系, 有效抑制 EGFR 上全部酪氨酸磷酸化位点。磷酸化位点 Tyr1173 和 Tyr992 敏感性较低, 需要高浓度 Gefitinib 才能抑制。Gefitinib 作用于 NR6W 细胞, 高效阻断 PLC-γ 磷酸化, IC50			

	为 27nM。NR6wtEGFR 和 NR6M 细胞系具有低水平 PLC-γ 磷酸化，IC50 分别为 43 nM 和 369 nM。Gefitinib 抑制 AKT 磷酸化，作用于低 EGFR 和 EGFRvIII 表达的细胞系，IC50 分别为 220 和 263nM。Gefitinib 按 0.1 到 0.5μM 剂量处理，显著促进而不是废除 NR6M 细胞形成集落。然而，2μM Gefitinib 完全抑制 NR6M 集落形成。Gefitinib 作用于高和低 EGFR 表达的细胞系，EGF 刺激 72 小时后，快速抑制 EGFR 和 ERK 磷酸化，这种作用存在剂量依赖性。Gefitinib 抑制 EGF 驱动的未转化 MCF10A 细胞生长 IC50 为 20 nM。Gefitinib 作用于 MDA-MB-231 细胞，抑制 EGF 信号。Gefitinib 严重抑制细胞数的增多，这种作用存在剂量依赖性。
体内研究	Gefitinib 作用于无胸腺裸鼠，抑制 SKOV3 或 MDA-MB-231 肿瘤生长。Gefitinib 高效作用于两种类型肿瘤。处理 14 天后，MDA-MB-231 肿瘤和 SKOV3 肿瘤生长抑制分别为 71%和 32%。

产品用途: 科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面。仅供科研严禁用于人体。

使用方法推荐：

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.2376 mL	11.1882 mL	22.3764 mL
5 mM		0.4475 mL	2.2376 mL	4.4753 mL
10 mM		0.2238 mL	1.1188 mL	2.2376 mL
50 mM		0.0448 mL	0.2238 mL	0.4475 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验：	Cell lines: NR6, NR6M 和 NR6W 细胞 Concentrations: 0 μM -2 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 呈指数生长的细胞，包括 NR6, NR6M, NR6M 和 NR6W 细胞按 6 倍接种在 96 孔板上，每孔为 2000 个细胞，粘附，随后在 PBS 中清洗，然后在含 0.5% FCS 的培养基上温育过夜。使用不同浓度(0-2 μM) Gefitinib 或溶质对照 DMSO 和 EGF 处理细胞。诱导 NR6wtEGFR 和 NR6W 细胞增殖的 EGF 最佳浓度已经测定，因此 NR6wtEGFR 和 NR6W 细胞中分别加入 10 nM 和 0.1 nM EGF。NR6 和 NR6M 细胞中不加入 EGF。72 小时后，通过 MTT 增殖检测测量细胞数。
动物实验：	Animal Models: 携带 SKOV3 或 MDA-MB-231 肿瘤的无胸腺裸鼠 Formulation: 0.2% DMSO Dosages: 75 mg/kg Administration: 饲喂处理

【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

- Comprehensive two-dimensional PC-3 prostate cancer cell membrane chromatography for screening anti-tumor components from Radix Sophorae flavescens.

- A fluorescent light-up aggregation-induced emission probe for screening gefitinib-sensitive non-small cell lung carcinoma.
- Enoxaparin Sensitizes Human Non-Small-Cell Lung Carcinomas to Gefitinib by Inhibiting DOCK1 Expression, Vimentin Phosphorylation, and Akt Activation.
- On-line comprehensive two-dimensional HepG2 cell membrane chromatographic analysis system for charactering anti-hepatoma components from rat serum after oral administration of Radix scutellariae: A strategy for rapid screening active compounds in vivo.
- Development of APTES-decorated HepG2 cancer stem cell membrane chromatography for screening active components from Salvia miltiorrhiza.

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：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。