

Lapatinib base ; 拉帕替尼

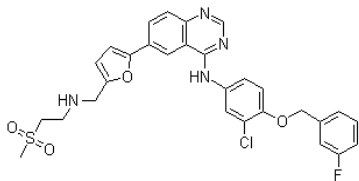
产品编号：MB1463

质量标准：>98.5%,可用于细胞培养

包装规格：100MG;1G;5G

产品形式：淡黄色至黄色固体

基本信息

分子式	C29H26ClFN4O4S	结构式	
分子量	581.06		
CAS No.	231277-92-2		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (172.09 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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。		

简介：拉帕替尼 Lapatinib 是有效的 EGFR 和 ErbB2 抑制剂，IC50 分别为 10.2 和 9.8 nM。

别名：GW-572016, GSK572016 ; Lapatinib base ; 拉帕替尼;N-[3-氯-4-[(3-氟苯基)甲氧基]苯基]-6-[5-[(2-甲磺酰乙基氨基)甲基]-2-咪唑基]喹唑啉-4-胺;Tykerb;GW572016;

N-[3-Chloro-4-[(3-fluorophenyl)methoxy]phenyl]-6-[5-[(2-methylsulfonyl ethylamino)methyl]-2-furyl]quinazolin-4-amine

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

熔点：.....137-139 °C

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (172.09 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

干燥失重：.....≤1.0%

含量：.....>98.5%,可用于细胞培养

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Lapatinib，以 Lapatinib Ditosylate 的形式使用，是一种有效的 EGFR 和 ErbB2 抑制剂，在无细胞试验中 IC50 分别为 10.2 和 9.8 nM。		
特性	Lapatinib 已经批准用于治疗 HER-2 阳性转移性乳腺癌。		
靶点	ErbB2 (Cell-free assay)	EGFR (Cell-free assay)	ErbB4 (Cell-free assay)
	9.2 nM	10.8 nM	367 nM
体外研究	除了 ErbB-4 例外，Lapatinib 作用于 EGFR 和 ErbB-2 比作用于其他测试的激酶 如 c-Src, MEK 和 ERK 选择性高 300 多倍。Lapatinib 处理，抑制 EGFR 和 ErbB-2 受体自磷酸化，这种作用存在剂量依赖性，作用于 BT474 和 HN5 细胞时，IC50 分别为 0.17 和 0.08 μM。Lapatinib		

	作用于 EGFR-和 ErbB-2-过量表达的肿瘤细胞,抑制 EGFR 和 ErbB-2 自磷酸化,比作用于纯化酶的效力低 10 倍左右。Lapatinib 抑制 EGFR- 和 ErbB-2 过量表达的细胞生长,而 OSI-774 和 Iressa (都为 EGFR 选择性抑制剂) 优先抑制 EGFR 过量表达的细胞生长。Lapatinib 作用于肿瘤细胞比作用于正常成纤维细胞效果高 100 倍左右。ErbB-2 转染的乳腺上皮细胞 HB4a c5.2, 对 Lapatinib 的反应敏感度比未转染的亲本对照细胞 HB4a 高 40 倍左右。使用不含 Lapatinib 的培养基培养 HN5 细胞群 2 周左右后,使用 30 μM Lapatinib 短暂处理,完全抑制细胞生长。浓度 > 3.3 μM 时抑制 50% 生长。浓度为 0.37 μM 时抑制 20% 生长。另一种 EGFR 过量表达的细胞 A-431, 与 HN5 反应相似。Lapatinib 在抑制 EGFR 过量表达的细胞生长方面与 OSI-774 相似。
体内研究	Lapatinib 有效抑制 BT474 和 HN5 人类移植瘤生长。使用 30 和 100 mg/kg Lapatinib 口服给药携带肿瘤的小鼠,每天两次,抑制肿瘤生长,这种作用存在剂量依赖性。按 100 mg/kg 剂量处理完全抑制肿瘤生长。按这种剂量处理,在处理 21 天期间,有 <10% 肿瘤损失。

美仑相关产品推荐

MB1134	Lapatinib Ditosylate
MB3981	AEE788 (NVP-AEE788)
MB3952	AZD8931 (Sapitinib)
MB3953	CP-724714
MB3954	Mubritinib (TAK 165)
CL-10123	Varlitinib

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。拉帕替尼 Lapatinib 是有效的 EGFR 和 ErbB2 抑制剂。可以用于相关领域的科学研究。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7210 mL	8.6050 mL	17.2099 mL
5 mM	0.3442 mL	1.7210 mL	3.4420 mL
10 mM	0.1721 mL	0.8605 mL	1.7210 mL
50 mM	0.0344 mL	0.1721 mL	0.3442 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	体外 EGFR, ErbB-2,和 ErbB4 激酶实验 : 从杆状病毒表达系统中纯化 EGFR, ErbB-2, 和 ErbB4 的细胞内激酶域。EGFR, ErbB-2, 和 ErbB-4 反应在 96 孔聚苯乙烯圆底板中进行,终体积为 45 μL。反应混合物含 50 mM 4-吗啉基丙磺酸(pH 7.5), 2 mM MnCl ₂ ,10 μM ATP, 1 μCi [γ- ³³ P] ATP/每次反应,50 μM Peptide A [生物素-(氨基酸)-EEEEYFELVAKKK-CONH ₂],1 mM 二硫苏糖醇, 及 1 μL 含连续稀释 Lapatinib (初浓度为 10 μM) 的 DMSO。加入指定纯化的 1 型受体细胞内域开始反应。加入的酶量为 1 pmol/每次反应 (20 nM)。在 23oC 反应 10 分钟,加入溶于水的 45 μL 0.5% 磷酸后,终止反应。最终反应混合物(75 μL) 转移到磷酸纤维素过滤板上。过滤实验板,使用 200 μL
-------------	---

	0.5% 磷酸冲洗三次。每孔中加入闪烁混合物(50 μL),使用 Packard Topcount 计数而量化实验结果。
细胞实验	<p>Cell lines: HFF , BT474, MCF-7, N87, CaLu-3, HN5, A-431, T47D, HB4a, 和 HB4a c5.2</p> <p>Concentrations: 0 到 100 nM</p> <p>Incubation Time: 3 天</p> <p>Method: 按以下密度接种细胞 : HFF, 1.5×10⁴ 个细胞/cm²; BT474, MCF-7, N87, 和 CaLu-3, 3×10⁴ 个细胞/cm²; 及 HN5, A-431, T47D, HB4a, 和 HB4a c5.2, 1×10⁴ 个细胞/cm² , 使在实验期间细胞处于对数生长期。24 小时后,使用浓度范围为 0 到 100 nM 的 Lapatinib 处理细胞。在含 5% FBS, 50 μg/mL gentamicin, 和 0.3% v/v DMSO 的低糖 DMEM 培养基中处理 HFF, BT474,HN5, 和 N87 细胞。在 50% 高糖 DMEM,和 50%含 5% FBS, 50 μg/mL gentamicin, 和 0.3% v/v DMSO 的低糖 DMEM 中处理 MCF-7 细胞。在 50% RPMI,50%含 5% FBS, 50 μg/mL gentamicin, 和 0.3% v/v DMSO 的低糖 DMEM 中处理 T47D, A-431, 和 CaLu-3 细胞。在 50% DMEM, 50% 含 5% FBS, 2.5 μg/mL hydrocortisone, 2.5 μg/mL 胰岛素, 25 μg/mL hygromycin B, 50 μg/mL gentamicin, 和 0.3% v/v DMSO 的 RPMI 1640 中处理 HB4a 和 HB4a c5.2 细胞。3 天后, 使用亚甲基蓝染色测评相对细胞数。移除培养基, 每孔加入溶解在 50% 乙醇和 50% 水中的 100 μL 0.5% w/v 亚甲基蓝。浸泡在去离子水中洗涤实验板, 然后在空气中烘干。每孔加入溶解在 PBS 的 1% w/v n-lauroylsarcosine(100 μL), 然后实验板在室温下温育 30 分钟。使用 Spectra 酶标仪在 620 nm 处测定吸光值。</p> <p>(Only for Reference)</p>
动物实验 :	<p>Animal Models: 雌性 CD-1 裸鼠和雌性 C.B-17 SCID 小鼠</p> <p>Formulation: 磺丁基醚-β-环糊精的 10%水溶液</p> <p>Dosages: 100 mg/kg</p> <p>Administration: 口服, 每天两次</p>

【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。

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。