

## Erlotinib ; 埃罗替尼

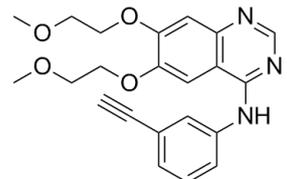
产品编号 : MB1734

质量标准 : >99%,BR,细胞培养级

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 类白色至微黄色粉末

### 基本信息

分子式	C22H23N3O4	结 构 式	
分子量	393.44		
CAS No.	183321-74-6		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 78 mg/mL (198.25 mM)		
	Ethanol : 15 mg/mL warmed (38.12 mM)		
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 :** 埃罗替尼 Erlotinib 抑制纯化的 **EGFR** 激酶, **IC<sub>50</sub>** 为 2 nM。

**别名 :** NSC 718781; OSI-744; R1415 ; 4-Quinazolinamine,

N-(3-ethynylphenyl)-6,7-bis(2-methoxyethoxy)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....类白色至微黄色粉末

溶解性 : .....DMSO : 78 mg/mL (198.25 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 15 mg/mL warmed (38.12 mM)

干燥失重 : .....≤1.0%

含量 : .....>99%

**储存条件 :** 常温, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Erlotinib 是一种 <b>EGFR</b> 抑制剂, <b>IC<sub>50</sub></b> 为 2 nM, 对 EGFR 的敏感性比对人 c-Src 或 v-Ab 高 1000 多倍。		
<b>靶点</b>	<table border="1" style="width: 100%;"> <tr> <td style="text-align: center;">EGFR (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td style="text-align: center;">2 nM</td> </tr> </table>	EGFR (Cell-free assay)	2 nM
EGFR (Cell-free assay)			
2 nM			
<b>体外研究</b>	Erlotinib HCl 有效抑制完整细胞, 包括 HNS 人头颈部肿瘤细胞(IC <sub>50</sub> 20nM), DiFi 人结肠癌细胞和 MDA MB-468 人乳腺癌细胞中 EGFR 活化。Erlotinib HCl (1 μM)在 DiFi 人结肠癌细胞中诱导细胞凋亡。Erlotinib 抑制一组 NSCLC 细胞系, 包括 A549, H322, H3255, H358, H661, H1650, H1975, H1299, H596 的生长, IC <sub>50</sub> 范围为 29 nM 到 >20 μM。Erlotinib HCl(2 μM) 显著抑制 AsPC-1 和 BxPC-3 胰细胞生长。Erlotinib HCl 与 gemcitabine 结合使用, 在 KRAS 突变的胰腺癌细胞中具有协同作用。10 微摩尔 Erlotinib HCl 抑制 Y845 (Src 依赖性磷酸化)和		

	Y1068 (自身磷酸化)位点的 EGFR 磷酸化。结合 Erlotinib HCl 能够下调 rapamycin 刺激的 Akt 活性, 并产生协同的细胞生长抑制作用。
<b>体内研究</b>	在 100 mg/kg 剂量下, Erlotinib HCl 完全防止 EGF 诱导的异种移植人 HN5 肿瘤的无胸腺小鼠体内 EGFR 自身磷酸化, 和治疗小鼠的肝 EGFR 自身磷酸化。Erlotinib HCl (100 mg/Kg)抑制 H460a 和 A549 肿瘤模型, 分别具有 71 和 93%的抑制率。

**美仑相关产品推荐**

MB1096	盐酸埃罗替尼
MB1096-S	盐酸埃罗替尼 (标准品)

**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。埃罗替尼是表皮生长因子受体 (EGFR) /人表皮生长因子受体 I (也称为 HER1) 的酪氨酸激酶抑制剂。埃罗替尼可有效抑制细胞内的 EGFR 磷酸化, EGFR 通常表达于正常细胞和肿瘤细胞的表面。在非临床试验模型中, EFGF 磷酸化的抑制可引起细胞生长停滞和/或细胞死亡。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5417 mL	12.7084 mL	25.4168 mL
5 mM	0.5083 mL	2.5417 mL	5.0834 mL
10 mM	0.2542 mL	1.2708 mL	2.5417 mL
50 mM	0.0508 mL	0.2542 mL	0.5083 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>激酶试验:</b></p> <p>96 孔板与 100 <math>\mu</math>L/孔 0.25 mg/mL PGT 的 PBS 溶液在 37°C 下培养过夜进行涂层。过量 PGT 通过抽吸移除 板用洗涤缓冲液(0.1% Tween 20 的 PBS 溶液)清洗 3 次。激酶反应在 50 <math>\mu</math>L 50 mM HEPES (pH 7.3)中进行, 反应液中包含 125 mM 氯化钠, 24 mM 氯化镁, 0.1 mM 原钒酸钠, 20 <math>\mu</math>M ATP, 1.6 <math>\mu</math>g/mL EGF, 和 15 ng 从 A431 细胞膜亲和纯化的 EGFR。加入 Erlotinib HCl 的 DMSO 溶液, 终 DMSO 浓度为 2.5%。磷酸化作用通过加入 ATP 起始, 并在室温下恒定振荡进行 8 分钟。激酶反应通过抽吸反应混合物终止, 并用洗涤缓冲液清洗 4 次。磷酸化的 PGT 通过与 50 <math>\mu</math>L/孔 HRP 偶联的 PY54 抗磷酸酪氨酸抗体(在封闭缓冲液(3% BSA 和 0.05% Tween 20 的 PBS 溶液)中稀释为 0.2 <math>\mu</math>g/mL)培育 25 分钟进行测量。通过抽吸移除抗体, 将板用洗涤缓冲液清洗 4 次。比色信号通过加入 50<math>\mu</math>L/孔 TMB 微孔过氧化物酶底物产生, 通过加入 50 <math>\mu</math>L/孔 0.09 M 硫酸停止。磷酸酪氨酸通过测量 450 nm 下吸光度进行估计。对照组信号通常为 0.6-1.2 吸收单元, 没有 AIP, EGFR, 或 PGT 的孔中基本上没有背景干扰, 并且该信号与 10 分钟的培养时间成比例。</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: A549, H322, H3255, H358 H661, H1650, H1975, H1299, H596 细胞</p> <p>Concentrations: 30 nM-20 <math>\mu</math>M</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 以指数生长的细胞以一式三份接种在 96 孔塑料板, 并暴露于连续稀释的 erlotinib, pemetrexed, 或 4:1 固定浓度比的结合物, 培养 72 小时。细胞活性通过细胞计数和 MTT 法测</p>

	定。生长抑制表示为药物处理组与 PBS 处理的对照组细胞(认为 100%存活)中存活细胞的百分比。IC50 值是与未处理的对照组细胞相比，在药物中暴露 72 小时，导致 50%细胞生长抑制的浓度，通过 CalcuSyn 软件计算。
动物实验	Animal Models: 负荷 HPAC 细胞的雄性 5 周大的 BALB-nu/nu 小鼠 Formulation: 6% Captisol Dosages: 50 mg/kg Administration: 口服给药

**【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。