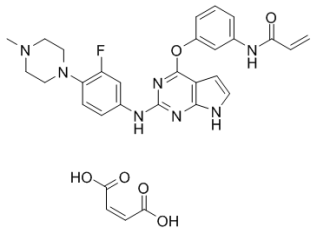
Avitinib maleate；艾维替尼马来酸盐

产品编号：MB2890
质量标准：>98%,BR
包装规格：5MG；25MG
产品形式：淡黄色至黄色固体

基本信息

分子式	C30H30FN7O6	结构式	
分子量	603.6		
CAS No.	1557268-88-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: ≥300 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。		

简介: 艾维替尼马来酸盐 Avitinib maleate 是一种基于吡咯并嘧啶的不可逆的表皮生长因子受体（EGFR）抑制剂，IC50 值为 7.68 nM。

别名：2-Propenamide, N-[3-[[2-[[3-fluoro-4-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]amino]-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl]oxy]phenyl]-, (2Z)-2-butenedioate (1:1)

物理性状及指标：

外观：……淡黄色至黄色固体
溶解性：……DMSO: ≥300 mg/mL
纯度：……>98%,BR
储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性及研究进展

产品描述	艾维替尼马来酸盐 Avitinib maleate 是一种基于吡咯并嘧啶的不可逆的表皮生长因子受体（EGFR）抑制剂，IC50 值为 7.68 nM。
靶点	EGFR 7.68 nM (IC_{50})
体外研究	Avitinib 在结构上不同于以前报道的基于嘧啶的不可逆 EGFR 抑制剂，如奥西米尼（osimertinib）和洛昔替尼（rociletinib）。 Avitinib 专门设计用于抑制 EGFR 活性突变，T790M 获得耐药突变，同时节省野生型 EGFR。 与野生型 EGFR 相比，Avitinib 选择性抑制 EGFR 活性和 T790M 突变，效价增加高达 298 倍。Avitinib 表现出强效的抑制活性，对 EGFR L858R / T790M 双重突变的 IC50 值为 0.18 nM，比野生型 EGFR 的效价高近 43 倍（IC50 = 7.68 nM）。 Avitinib 选择性抑制突变型 EGFR 磷酸化，NCI-H1975 和 NIH / 3T3_TC32T8 细胞的 IC50 值分别为 7.3 nM 和 2.8 nM，比 A431 中抑制野生型 EGFR 的灵敏度高 115 和 298 倍。
体内研究	每日 500 毫克/公斤剂量口服阿维替尼可使 EGFR 活性和 T790M 突变的肿瘤完全缓解 143 天以上，

	且无体重减轻。 测试了 avitinib 的三种主要代谢物，并且未显示野生型 EGFR 抑制和脱靶效应，例如抑制 IGF-1R。 Avitinib 在非小细胞肺癌（NSCLC）患者中安全，剂量范围为 50 mg 至 550 mg，每天一次，未检测到高血糖症和其他严重不良反应，如 3 级 QT 间期延长。

美仑相关产品推荐

MB4654	CO-1686
MB3981	AEE788 (NVP-AEE788)
MB3979	AG-1478 (Tyrphostin AG-1478)
MB3990	AG-18
MB5631	AV-951
MB3952	AZD8931 (Sapitinib)
MB4527	BFH772
CL-11216	BIBX 1382
MB3946	BMS-794833
MB2026	BMS582664
CL-10162	Brivanib (BMS-540215)
MB3989	CNX-2006
MB5710	CUDC101
MB4530	ENMD-2076
CL-10168	ENMD-2076 L-(+)-Tartaric acid
MB7343	Foretinib (GSK1363089)
MB3943	Golvatinib (E7050)
MB6166	PF299804（EGFR 抑制剂）
CL-10148	RAF265 (CHIR-265)
CL-10173	Raf265 derivative
MB3996	SAR131675
MB3944	Semaxanib (SU5416)

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。艾维替尼马来酸盐 Avitinib maleate 是一种基于吡咯并嘧啶的不可逆的表皮生长因子受体（EGFR）抑制剂，用于肿瘤、癌症等相关科研领域研究。

储液配置

体积 \ 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.6567 mL	8.2836 mL	16.5673 mL
5 mM	0.3313 mL	1.6567 mL	3.3135 mL
10 mM	0.1657 mL	0.8284 mL	1.6567 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	通过细胞活力试剂 WST-1 测定细胞增殖。 将细胞以最佳密度接种到 96 孔板上并温育 24 小时，

	然后用 avitinib 处理 72 小时。 然后通过用 WST-1 试剂孵育细胞 2-3 小时来测定细胞活力
动物实验	Avitinib 在 0.5%MC 中制备。 大鼠 :为了评估阿维替尼潜在的皮肤毒性 ,使用大鼠模型。 大鼠每天服用 300 mg / kg 的 avitinib 4 周，对照组服用 50 mg / kg 的吉非替尼或载体对照（0.5%MC）。 小鼠：当赋形剂对照组的 TV 值达到约 2000mm 3 时，用载体对照（0.5%MC），12.5mg / kg 和 50mg / kg 剂量水平的阿维替尼口服 NCI-H1975 荷瘤小鼠 17 天。 在给药 17 天后，处死载体对照组中的动物，而在 avitinib 组中的动物不断每天以 500mg / kg 的剂量增加给药，直至试验小鼠不能耐受治疗。 每周测量鼠标体重和电视两次。 然后将 TV 用于计算肿瘤抑制率和肿瘤退化率

【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。