

EAI045

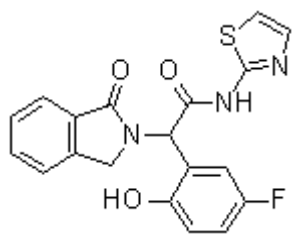
产品编号：MB3394

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C19H14FN3O3S	结构式	
分子量	383.40		
CAS No.	1942114-09-1		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 76 mg/mL (198.22 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：EAI045 是突变体 EGFR 变构抑制剂，在 10 μM ATP 时抑制 EGFR，EGFR L858R，EGFR T790M 和 EGFR L858R/T790M 的 IC₅₀ 值分别为 1.9，0.019，0.19 和 0.002 μM。

别名：2H-Isoindole-2-acetamide, α-(5-fluoro-2-hydroxyphenyl)-1,3-dihydro-1-oxo-N-2-thiazolyl

物理性状及指标：

外观：.....白色至卡其色粉末

溶解性：.....DMSO : 76 mg/mL (198.22 mM);Water : Insoluble;Ethanol : Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	EAI045 是一种靶向特定耐药性的 EGFR 突变体的变构抑制剂。对野生型受体无作用。
靶点	EGFR mutants
体外研究	EAI045 有效抑制 H1975 细胞中 EGFR(Y1173)的磷酸化 (EC ₅₀ =2 nM)，但在具有野生 EGFR 的 HaCaT 细胞（角质形成细胞系）中无此效果。尽管 EAI045 对 EGFR 的突变体有抑制作用，但在 H1975 和 H3255 细胞中，尽管浓度达到了 10 μM，EAI 也没有抗增殖作用。EAI045 能够抑制 EGFR (L858R 和 T790M) 突变体，IC ₅₀ 为 3 nM。然而，它不能够完全阻止具有 EGFR (L858R/T790M) 突变体的 H1975 细胞中 EGFR 的自身磷酸化。二聚作用有缺陷的/独立的突变体对 EAI045 更敏感。因为 EGFR 的激酶激活需要形成二聚体，EAI045 可能对 EGFR 异聚体的某一个亚基具有抑制活性。
体内研究	在小鼠中进行的药代动力学研究表明 EAI045 的最大血浆浓度为 0.57 μM，其半衰期为 2.15 小时。在给药浓度为 20 mg/kg 的情况下，其生物利用率为 26%。当 EAI045 与另一阻止 EGFR 二聚的化合物 cetuximab 结合使用时，在具有 EGFR (L858R/T790M) 突变体驱动下的肺癌小鼠模型中，EAI045 能显著的减少肿瘤生长。单独 EAI045 给药的小鼠则没有治疗效果。EAI045 与 cetuximab 结合使用还能在具有 L858R/T790M/C797S 突变的小鼠中诱导肿瘤体积缩小。说明 EAI045 和

cetuximab 具有协同作用。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB7343	Foretinib (GSK1363089)
MB3943	Golvatinib (E7050)
MB3945	Ki8751

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。EAI045 是一种靶向特定耐药性的 EGFR 突变体的变构抑制剂。可作为相关领域的科研试剂。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6082 mL	13.0412 mL	26.0824 mL
5 mM	0.5216 mL	2.6082 mL	5.2165 mL
10 mM	0.2608 mL	1.3041 mL	2.6082 mL
50 mM	0.0522 mL	0.2608 mL	0.5216 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验 :	Cell lines: H1975, H3255 和 HaCaT 细胞 Concentrations: 0-100 μ M Incubation Time: 3 天 Method: 将 H1975, H3255 和 HaCaT 细胞以每空 500 个细胞的密度铺于 384 孔, 加入含 10% FBS 的 RPMI (青霉素/链霉素) 培养基。将 50 nL 连续稀释的化合物加入到细胞培养基中, 3 天后, 测定其细胞活力。
动物实验 :	Animal Models: 携有 EGFR(TL) (L858R/T790M 点突变)和 EGFR(TD) (exon19del/T790M 点突变)的小鼠 Formulation: 10% NMP (10% 1-methyl-2-pyrrolidinone:90% PEG-300) Dosages: 60 mg/kg Administration: 口服

【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。