

AZD8931 ; Sapitinib

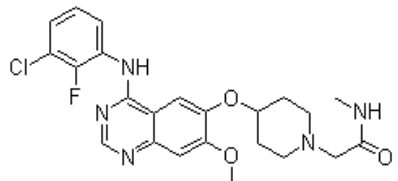
产品编号 : MB3952

质量标准 : >98% , EGFR, ErbB2 和 ErbB3 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

| | | | |
|-----------|---|-------------|---|
| 分子式 | C23H25ClFN5O3 | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 473.93 | | |
| CAS No. | 848942-61-0 | | |
| 储存条件 | -20°C , 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性(25°C) | DMSO : 40 mg/mL (84.4 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 : Sapitinib (AZD-8931)是可逆的, ATP 竞争型 EGFR 抑制剂, 作用于 EGFR, ErbB2 和 ErbB3。

别名 : AZD-8931 ; 1-Piperidineacetamide,沙普替尼 4-[[4-[(3-chloro-2-fluorophenyl)amino]-7-methoxy-6-quinazolinyl]oxy]-Nmethyl

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 40 mg/mL (84.4 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 | Sapitinib (AZD8931)是一种可逆的, ATP 竞争性 EGFR, ErbB2 和 ErbB3 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 分别为 4 nM, 3 nM 和 4 nM, 作用于 NSCLC 细胞比 Gefitinib 或 Lapatinib 更有效, 作用于 ErbB 家族比作用于 MNK1 和 FIt 选择性强 100 倍。 | | |
| 靶点 | ErbB2 (Cell-free assay) | EGFR (Cell-free assay) | ErbB3 (Cell-free assay) |

| | | | |
|-------------|--|------|------|
| | 3 nM | 4 nM | 4 nM |
| 体外研究 | AZD8931 作用于 NSCLC 和 SCCHN 细胞系的效果不同。AZD8931 高度选择性作用于 PC-9 细胞 (EGFR 激活突变型), GI50 为 0.1 nM, 而低活性作用于 NCI-1437 细胞, GI50 >10 μM。与 lapatinib 或 gefitinib 相比, AZD8931 作用于 PE/CA-PJ41, PE/CA-PJ49, DOK 和 FaDu 细胞, 更有效作用于 p-EGFR, p-erbB2 和 p-erbB3。 | | |
| 体内研究 | AZD8931 作用于 BT474c, Calu-3, LoVo, FaDu 和 PC-9 移植瘤, 具有抗肿瘤活性。AZD8931 急性处理 BT474c 移植瘤, 可降低 p-AKT, Ki67 表达和 p-ERK。AZD8931 可诱导产生 M30 凋亡标记。而且, 与 gefitinib 和 lapatinib 相比, AZD8931 治疗 LoVo 移植瘤, 具有更有效的促凋亡效果。 | | |

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)

| | |
|--------|--------------------|
| MB3934 | Semaxanib(SU-5416) |
| MB3985 | TAK-285 |
| MB3995 | Telatinib |

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。Sapitinib (AZD8931) 是一种可逆的, ATP 竞争性 EGFR, ErbB2 和 ErbB3 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

| 体 浓度 | 质量 积 | | |
|---------|-----------|------------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 2.1100 mL | 10.5501 mL | 21.1002 mL |
| 5 mM | 0.4220 mL | 2.1100 mL | 4.2200 mL |
| 10 mM | 0.2110 mL | 1.0550 mL | 2.1100 mL |
| 50 mM | 0.0422 mL | 0.2110 mL | 0.4220 mL |

经典实验操作 (仅供参考)

| | |
|-------------|--|
| 激酶实验 | 分离的激酶实验: 人类 EGFR 和 erbB2 细胞内激酶域在杆状病毒/Sf21 系统中克隆和表达。使用 ATP 在 Km 浓度 (0.4 mM 测定 erbB2, 2 mM 测定 EGFR), 使用 ELISA 法测定 AZD8931 的一种活性。 |
| 细胞实验 | Cell lines: 头颈部肿瘤细胞系(KYSE-30, OE21, PE/CA-PJ15, PE/CA-PJ34 (克隆 C12), PE/CA-PJ41 (克隆 D2), PE/CA-PJ49, DOK, Detroit562, RPMI2650, SCC-4, SCC-9, SCC-25, |

| | |
|------|--|
| | CAL 27, SW579, FaDu, Hs 840.T, KB, KYSE-450, 和 HEp-2, HN5) 和 NSCLC 细胞系 (PC-9, Calu-3, NCI-H2073, NCI-H1623, NCI-H522, Concentrations: 0.001-10 μ M Incubation Time: 96 小时 Method: 为了测定 AZD8931 体外抗细胞增殖活性, 使用 AZD8931 处理一组 NSCLC 和 SCCHN 细胞系。细胞和 AZD8931 (0.001-10 μ M) 温育 96 小时。细胞和 MTS 比色分析实验试剂温育 4 小时而测定存活细胞数, 然后通过分光光度计在 490 nm 处测量吸光值。 |
| 动物实验 | Animal Models: 携带 BT474c, Calu-3, LoVo, FaDu 和 PC-9 移植瘤的 Swiss 裸鼠或 SCID 小鼠 Formulation: 悬浮在溶于去离子水的 1% (v/v) Tween-80 溶液中 Dosages: 6.25-50 mg/kg Administration: 口服饲喂 |

【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(M ²) | 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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。