

PD153035 HCl

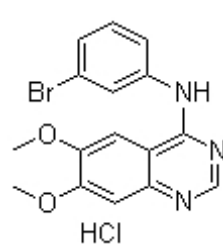
产品编号：MB3980

质量标准：>98%，特异性 EGFR 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C16H14BrN3O2.HCl	结 构 式	
分子量	396.67		
CAS No.	183322-45-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO : 0.5 mg/mL (1.26 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：PD153035 (ZM 252868;AG 1517;Tyrophostin AG 1517;SU 5271) 是有效地 EGFR 抑制剂。

别名：ZM 252868; AG 1517; SU 5271 ; 4-Quinazolinamine, N-(3-bromophenyl)-6,7-dimethoxy-, hydrochloride (1:1)

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 0.5 mg/mL (1.26 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PD153035 是有效的，特异性 EGFR 抑制剂，Ki 和 IC50 分别为 5.2 pM 和 29 pM;对 PGDFR, FGFR, CSF-1, InsR 和 Src 几乎无作用效果。
靶点	EGFR
IC50	5.2 pM (Ki)
体外研究	PD153035 抑制 A-431 人扁平上皮癌相关的表皮生长因子受体酪氨酸激酶，Ki 为 5.2 pM，IC50 为 29 pM。而且，PD 153035 作用于 Swiss 3T3 成纤维细胞和 A-431 人扁平上皮癌细胞，有效且选择性抑制 EGF 诱导的酪氨酸磷酸化，IC50 分别为 15 nM 和 14 nM。PD153035 作用于过量表达 EGF 受体的人癌细胞系，包括 A431, Difi, DU145, MDA-MB-468 和 ME180 细胞，抑制生长，IC50 分别为 0.22 μM, 0.3μM, 0.4 μM, 0.68 μM 和 0.95 μM。PD153035 抑制鼻咽癌 (NPC) 细胞，包括 NPC-TW01, NPC-TW04, 和 HONE1 细胞系，这种作用存在剂量依赖性，IC50 分别为 12.9 μM, 9.8 μM, 和 18.6μM。最新研究显示 PD153035 作用于 Caco-2 结肠癌细胞，废除 PAR(2) 激活肽 2-咪喃甲酰基-LIGRLO-NH(2)(2fLI) 诱导的 COX-2 表达。
体内研究	PD153035 按 80 mg/kg 剂量作用于携带 A431 人体表皮样癌细胞移植瘤的免疫缺陷裸鼠，抑制

	EGF 受体酪氨酸激酶活性。PD153035 作用于 HFD-fed 小鼠，促进耐糖量，胰岛素敏感性，和信号，且降低亚临床炎症。
特征	PD153035 是有效的表皮生长因子受体酪氨酸激酶选择性抑制剂。

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)

MB3981	AEE788 (NVP-AEE788)
MB3979	AG-1478 (Tyrphostin AG-1478)
MB3990	AG-18

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。本品是有效地 EGFR 抑制剂，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	2.5210 mL	12.6049 mL	25.2099 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>EGF 受体酪氨酸激酶抑制检测实验：</p> <p>在总体积为 0.1 mL 含 25 mM HEPES (pH 7.4), 5 mM MgCl₂, 2 mM MnCl₂, 50 μM 钒酸钠, 0.5 到 1.0 ng 酶 (也含充分 EGF, 确保终浓度为 2 μg/mL), 10 μM ATP 含 1 μCi [32P]ATP, 不同浓度 PD153035, 及 200 μM 肽底物的混合物中, 根据一部分含序列 Lys-His-Lys-Lys-Leu-Ala-Glu-Gly-Ser-Ala-Tyr472-Glu-Glu-Val 的酪氨酸激酶 C-γI, 进行酶反应。加入 ATP 开始反应。在室温下进行 10 分钟后, 加入 2 mL 75 mM 磷酸终止反应, 溶液通过一个 2.5-cm 与肽结合的磷酸纤维过滤盘。使用 75 mM 磷酸冲洗过滤器 5 次, 然后使用 5 mL 闪烁液使其置于小瓶中。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: A431, Difi, DU145, MDA-MB-468 和 ME180</p> <p>Concentrations: 0 到 3 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 细胞接种在 6 孔板上。第二天, 细胞转移到含 0.5% FBS 的培养基上, 培养 18 小时 然后加入不同浓度 PD153035。处理 72 小时后, 使用 PBS 清洗细胞, 使用溶于 PBS 的 0.1% 胰蛋白酶-1 mM EDTA 的收集, 然后使用 Coulter 计数器收集。CMK 细胞在悬浮液中生长, 因此, 不需要胰蛋白酶化。</p> <p>(Only for Reference)</p>
动物实验	<p>Animal Models: 注射 A431 细胞的远交系裸体小鼠</p> <p>Formulation: PD153035 溶于水</p> <p>Dosages: ≤80 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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。