

## PD-153035 ; PD153035

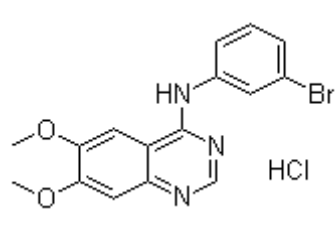
产品编号 : MB4291

质量标准 : >98%,BR

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.	153436-54-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	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 HCl 是一种有效的, 特异性 EGFR 抑制剂。

**别名 :** SU-5271 (AG1517) HCl ,ZM 252868 HCl ;  
 N-(3-bromophenyl)-6,7-dimethoxyquinazolin-4-amine hydrochloride

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

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

含量 : .....>98%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	PD153035 HCl 是一种有效的, 特异性 EGFR 抑制剂, 无细胞试验中 $K_i$ 和 $IC_{50}$ 分别为 5.2 pM 和 29 pM ; 对 PGDFR, FGFR, CSF-1, InsR 和 Src 几乎无作用。
<b>特性</b>	PD153035 是有效的表皮生长因子受体酪氨酸激酶选择性抑制剂。
<b>靶点</b>	EGFR (Cell-free assay) 5.2 pM( $K_i$ )
<b>体外研究</b>	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, $K_i$ 为 5.2 pM ,

	<p>IC50 为 29 <math>\mu</math>M。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 <math>\mu</math>M, 0.3<math>\mu</math>M, 0.4 <math>\mu</math>M, 0.68 <math>\mu</math>M 和 0.95 <math>\mu</math>M。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 <math>\mu</math>M, 9.8 <math>\mu</math>M, 和 18.6<math>\mu</math>M。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。</p>
<b>体内研究</b>	<p>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。</p>

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)

MB5631	AV-951
MB3952	AZD8931 (Sapitinib)
MB4527	BFH772

**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。PD153035 HCl 是一种有效的, 特异性 EGFR 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	2.5210 mL	12.6049 mL	25.2099 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<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 MgCl<sub>2</sub>, 2 mM MnCl<sub>2</sub>, 50 <math>\mu</math>M 钒酸钠, 0.5 到 1.0 ng 酶 (也含充分 EGF, 确保终浓度为 2 <math>\mu</math>g/mL), 10 <math>\mu</math>M ATP 含 1 <math>\mu</math>Ci [32P]ATP, 不同浓度 PD153035, 及 200 <math>\mu</math>M 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-yl, 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</p>
-------------	--

	瓶中。
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> A431, Difi, DU145, MDA-MB-468 和 ME180</p> <p><b>Concentrations:</b> 0 到 3 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 72 小时</p> <p><b>Method:</b> 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% 人胰蛋白酶-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>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 注射 A431 细胞的远交系裸体小鼠</p> <p><b>Formulation:</b> PD153035 溶于水</p> <p><b>Dosages:</b> <math>\leq</math>80 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 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 <sup>2</sup> )	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。