

## Icotinib ; 埃克替尼盐酸盐

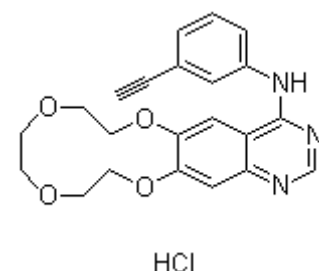
产品编号 : MB4293

质量标准 : >98% , 特异性 EGFR 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C22H21N3O4.HCl	结 构 式	 <p>HCl</p>
分子量	427.89		
CAS No.	1204313-51-8		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	10 mM in DMSO		
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 :** Icotinib Hydrochloride (BPI-2009)是有效, 选择性的 EGFR 抑制剂。

**别名 :** 盐酸埃克替尼 ; BPI-2009H ; [1,4,7,10]Tetraoxacyclododecino[2,3-g]quinazolin-4-amine, N-(3-ethynylphenyl)-7,8,10,11,13,14- hexahydro-, hydrochloride (1:1)

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....10 mM in DMSO

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>	Icotinib Hydrochloride (BPI-2009)是有效, 选择性的 EGFR 抑制剂, IC <sub>50</sub> 值为 5 nM ; 也抑制突变型 EGFR <sup>L858R</sup> , EGFR <sup>L858R/T790M</sup> , EGFR <sup>T790M</sup> 和 EGFR <sup>L861Q</sup> 。
<b>靶点</b>	IC <sub>50</sub> : 5 nM (EGFR)
<b>体外研究</b>	在 0.5μm 浓度下与 Iconitib 共同孵育, 激酶活性抑制率分别为 91%、99%、96%、61%和 61%。IC <sub>50</sub> s 为 1、4.06、12.16、16.08、40.71μm 时, IConib 抑制 a431 和 bgc-823 A549、h460 和 kb 细胞株的增殖, 当 IC <sub>50</sub> s 为 1、4.06、12.16、16.08、40.71μm 时, ICotinib 仅对 egfr 及其突变体显示有意义的抑制活性。在人表皮样癌 A431 细胞系中, 替尼可阻断 EGFR 介导的细胞内酪氨酸磷酸化 (IC <sub>50</sub> =45 nM), 并抑制肿瘤细胞增殖。

<b>体内研究</b>	在携带多种人类肿瘤来源异种移植物的裸鼠中，Icotinib 表现出有效的剂量依赖性抗肿瘤作用。在小鼠中，该药物的耐受剂量高达 120 mg/kg/天，在治疗期间没有死亡率或显著的体重减轻。在 A431 细胞系组中，以 25.2%、45.6%和 51.5%的速率抑制肿瘤生长；在 A549 细胞系组中，以 3.4%、25.9%和 31.0%的速率抑制肿瘤生长；在 H460 细胞系组中，以 49.4%、52.6%和 67.4%的速率抑制肿瘤生长；在 30、60 和 120 mg/kg/剂量下，以 30.3%、36.4%和 46.5%的速率抑制肿瘤生长。
-------------	--

**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)**

MB3986	Tyrphostin 9
MB5251	WZ4002
MB3997	ZM306416

**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。Icotinib Hydrochloride (BPI-2009)是有效，选择性的 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	2.3371 mL	11.6855 mL	23.3710 mL
5 mM	0.4674 mL	2.3371 mL	4.6742 mL
10 mM	0.2337 mL	1.1686 mL	2.3371 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	在体外激酶测定中，将 2.4 ng / $\mu$ LEGFR 蛋白与 32 ng / $\mu$ LCrk 在含有 1 $\mu$ M 冷 ATP 和 1 $\mu$ Ci32P- $\gamma$ -ATP 的 25 $\mu$ L 激酶反应缓冲液中混合。将混合物与 Icotinib 在 0,0.5,2.5,12.5 或 62.5nM 下在冰上温育 10 分钟，然后在 30 $^{\circ}$ C 温育 20 分钟。在 SDS 样品缓冲液中于 100 $^{\circ}$ C 淬灭 4 分钟后，通过在 10%SDS-PAGE 凝胶中电泳分离蛋白质混合物。然后暴露干燥的凝胶以检测放射性。通过软件进行量化。
<b>细胞实验</b>	Icotinib 在 DMSO 中制备。 将细胞 (1000 个/孔) 接种到含有 10%FBS 的 RPMI-1640 培养基中的 96 孔板中，并在 37 $^{\circ}$ C 下在 5%CO <sub>2</sub> 培养箱中生长。24 小时后，用 Icotinib 在 0,0.78,1.56,3.125,6.25,12.5 或 25 $\mu$ M 处理细胞 96 小时。 通过从第 4 天的平均吸光度值减去第 0 天的平均吸光度值来计算细胞增殖。
<b>动物实验</b>	对于含有 0.5%CMC Na 的水性载体中的每个剂量组，Icotinib 以所需浓度悬浮 小鼠： 在携带 A431，A549，H460 和 HCT8 肿瘤异种移植物的鼠中测定三剂 Icotinib (30,60 和 120mg / kg /剂量 p.o.qd) 对抗肿瘤活性和存活的影响。在这些实验中使用紫杉醇 (30mg / kg /剂量，每周一次) 作为阳性对照组。

**【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(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。