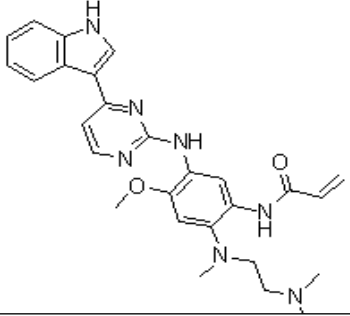


## AZ-5104

产品编号: MB4701  
质量标准: >98%,BR  
包装规格: 10MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C27H31N7O2	结 构 式	
分子量	485.58		
CAS No.	1421373-98-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 97 mg/mL (199.76 mM)		
	Water: Insoluble		
	Ethanol: 23 mg/mL warmed (47.36 mM)		
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:** AZ-5104 是 AZD 9291 的活性, 去甲基化代谢物。AZ-5104 是 EGFR 抑制剂; 抑制 EGFR<sup>L858R/T790M</sup>, EGFR<sup>L858R</sup>, EGFR<sup>L861Q</sup>, EGFR 和 ErbB4。

**别名:** 2-Propenamide, N-[2-[[2-(dimethylamino)ethyl]methylamino]-5-[[4-(1H-indol-3-yl)-2-pyrimidinyl]amino]-4-methoxyphenyl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO: 97 mg/mL (199.76 mM); Water: Insoluble; Ethanol: 23 mg/mL warmed (47.36 mM)

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>	AZ5104, 是 AZD-9291 的脱甲基代谢物, 是一种有效的 EGFR 抑制剂, 作用于 EGFR (L858R/T790M), EGFR (L858R), EGFR (L861Q), 和 EGFR (野生型), IC50 分别为 <1 nM, 6 nM, 1 nM, 和 25 nM。Phase 1。				
<b>靶点</b>	EGFR (L858R/T790M)	EGFR (L861Q)	EGFR (L858R)	ErbB4	EGFR (wildtype)
	<1 nM	1 nM	6 nM	7 nM	25 nM
<b>体外研究</b>	AZ5104 对 ex19del (2 nM 在 PC-9 中), T790M (2 nM 在 H1975 中), 和野生型 EGFR (33 nM 在 LOVO 中) 细胞系表现出良好的疗效。AZ5104 引起细胞活性的抑制, 对 H1975 (T790M/L858R), PC-9 (ex19del), Calu 3 (WT), 和 NCI-H2073 (WT) 的 IC50 分别为 3.3 nM,				

	2.6 nM, 80 nM, 和 53 nM。
<b>体内研究</b>	在 C/L858R 和 C/L+T 小鼠中, AZ5104 (5 mg/kg/d, p.o.)诱导显著且持续的肿瘤退化。

**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)**

MB3979	AG-1478 (Tyrphostin AG-1478)
MB3990	AG-18
MB5631	AV-951

**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 AZ-5104 是 AZD 9291 的活性,去甲基化代谢物。AZ-5104 是 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	2.0594 mL	10.2970 mL	20.5939 mL
5 mM	0.4119 mL	2.0594 mL	4.1188 mL
10 mM	0.2059 mL	1.0297 mL	2.0594 mL
50 mM	0.0412 mL	0.2059 mL	0.4119 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<b>重组激酶试验:</b> 对于蛋白激酶, 激酶试验使用多肽或蛋白质底物在过滤器结合的放射性 ATP 转移酶试验中进行, 对于脂质激酶, 使用脂质底物和 HTRF 试验进行。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 负荷 C/L858R 和 C/L+T 肿瘤的小鼠 <b>Formulation:</b> 1% Polysorbate 80 <b>Dosages:</b> 5 mg/kg/d <b>Administration:</b> p.o.

**【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。