

## WZ-4002 ; WZ4002

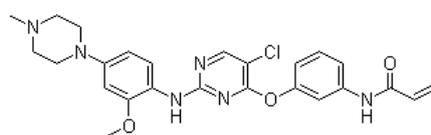
产品编号 : MB5251

质量标准 : >98% , 选择性的 EGFR 抑制剂

包装规格 : 20MG;100MG;500MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C25H27ClN6O3	结 构 式	
分子量	494.18		
CAS No.	1213269-23-8		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 13 mg/mL (26.3 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 : WZ4002 是突变选择性的 EGFR 抑制剂。

别名 : 2-Propenamide, N-[3-[[5-chloro-2-[[2-methoxy-4-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]oxy]phenyl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 13 mg/mL (26.3 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	WZ4002 是新型的, 突变选择性的 EGFR 抑制剂, 作用于 EGFR(L858R)/(T790M) 时 IC50 为 2 nM/8 nM; 对 ERBB2 磷酸化(T798I)没有抑制作用。	
靶点	EGFR L858R (BaF3 cells)	EGFR L858R/T790M (BaF3 cells)
IC50	2 nM	8 nM

<p><b>体外研究</b></p>	<p>WZ4002 也抑制其他 EGFR 基因型，如作用于 E746_A750 和 E746_A750/T790M 时 IC50 分别为 2 和 6 nM。WZ4002 作用于野生型 EGFR 时 IC50 为 32 nM。WZ4002 作用于非小细胞肺癌 ( NSCLC ) 细胞时抑制 EGFR, AKT 和 ERK1/2 的磷酸化作用。WZ4002 作用于表达不同 EGFR T790M 突变等位基因的 NIH-3T3 细胞时抑制 EGFR 的磷酸化作用。测定激酶的解离常数，WZ4002 作用下的实验组比 DMSO 作用下的对照组高 95%。WZ4002 由于在 C2 苯胺取代时获得一个正甲氧基团，因而作用于 EGFR 比 WZ3146 效果更高。与喹唑啉类抑制剂相比，WZ4002 作用于野生型 EGFR 磷酸化作用的效果要低 100 倍。WZ4002 抑制重组 L858R/T790M 蛋白 EGFR 激酶活性的效果比抑制野生型 EGFR 高很多，而 HKI-272 和 Gefitinib 的抑制效果刚好与 WZ4002 相反。此外,抗 Src TKI 的 H1975 细胞和 HCC827 细胞的 EGFR 的磷酸化完全被第三代 EGFR TKI, WZ4002 抑制。</p>
<p><b>体内研究</b></p>	<p>处理含有 T790M 突变鼠模型 2 周，用于研究 WZ4002 的功效，发现与对照组相比 WZ4002 处理导致明显的肿瘤退化。用低剂量 WZ4002,和高剂量 WZ4002 处理，导致平均摄取分别下降 26%和 36%。</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)**

<p>MB3944</p>	<p>Semaxanib (SU5416)</p>
<p>MB4529</p>	<p>TSU-68</p>
<p>MB3986</p>	<p>Tyrphostin 9</p>

**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。WZ4002 是突变选择性的 EGFR 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

<p>体 积 \ 质 量</p>	<p>1 mg</p>	<p>5 mg</p>	<p>10 mg</p>
<p>浓 度</p>	<p>2.0236 mL</p>	<p>10.1178 mL</p>	<p>20.2355 mL</p>
<p>1 mM</p>	<p>0.4047 mL</p>	<p>2.0236 mL</p>	<p>4.0471 mL</p>
<p>5 mM</p>	<p>0.2024 mL</p>	<p>1.0118 mL</p>	<p>2.0236 mL</p>
<p>10 mM</p>	<p>-</p>	<p>-</p>	<p>-</p>

**经典实验操作 ( 仅供参考 )**

<p><b>激酶实验</b></p>	<p><b>EGFR 激酶实验:</b> 在体外，96 孔板上，使用重组 EGFR<sup>L858R/T790M</sup> 蛋白和野生型 EGFR 蛋白通过 ATP/NADH 耦合分析系统测试抑制酶动力学。加入 WZ4002 测定抑制效果。</p>
--------------------	--

<b>细胞实验</b>	<b>Cell lines:</b> NSCLC, Ba/F3 细胞, NIH-3T3 细胞, PC9GR4 细胞 <b>Concentrations:</b> 0-1 $\mu$ M <b>Incubation Time:</b> 72 小时 <b>Method:</b> 通过直接测序法 (DS) 发现 PC9GR4 细胞含有 EGFR 缺失突变 E746_A750/T790M。使用 MTT 实验测定细胞增殖和生长。使用快速变化的定点突变试剂盒形成定点突变。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> EGFR-TL(T790M/L858R)鼠 <b>Formulation:</b> NMP(10% 1-甲基-2-吡咯烷酮 : 90% PEG-300) <b>Dosages:</b> 25mg/kg <b>Administration:</b> 饲喂处理

**【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。