

## WZ3146

产品编号：MB5284

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C24H25ClN6O2	结 构 式	
分子量	464.95		
CAS No.	1214265-56-1		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 93 mg/mL (200.02 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：**WZ3146 是突变选择性的 EGFR 抑制剂。

**别名：**WZ3146;WZ 3146;N-[3-[[5-Chloro-2-[[4-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]amino]-4-pyrimidinyl]oxy]phenyl]-2-propenamide

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 93 mg/mL (200.02 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

<b>产品描述</b>	WZ3146 是一种突变选择性的，不可逆 EGFR(L858R)和 EGFR(E746_A750)抑制剂，IC50 分别为 2 nM 和 2 nM；对 ERBB2 磷酸化(T798I)没有抑制作用。			
<b>特性</b>	Mutant-selective, irreversible.			
<b>靶点</b>	EGFR (L858R)	EGFR (E746_A750)	EGFR (L858R/T790M)	EGFR (E746_A750/T790M)
	2 nM	2 nM	5 nM	14 nM

<b>体外研究</b>	WZ3146 作用于 Ba/F3 细胞，选择性抑制 EGFR L858R, EGFR E746_A750, EGFR L858R/T790M 和 EGFR E746_A750/T790M 磷酸化, IC50 分别为 2 nM, 2 nM, 5 nM 和 14 nM。WZ3146 显著抑制含 EGFR 突变的细胞系生长，作用于含 EGFR Del E746_A750 的 HCC827 细胞时, IC50 为 3 nM，作用于含 EGFR Del E746_A750 的 PC9 细胞, IC50 为 15 nM，作用于含 EGFR L858R/T790M 的 H1975 细胞, IC50 为 29 nM，作用于含 EGFR Del E746_A750/T790M 的 PC9 GR 细胞, IC50 为 3 nM。
-------------	---

**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)**

MB3934	Semaxanib(SU-5416)
MB3985	TAK-285
MB3995	Telatinib

**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。WZ3146 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**

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1508 mL	10.7538 mL	21.5077 mL
5 mM	0.4302 mL	2.1508 mL	4.3015 mL
10 mM	0.2151 mL	1.0754 mL	2.1508 mL
50 mM	0.0430 mL	0.2151 mL	0.4302 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	体外抑制酶动力学分析 1: 使用 ATP/NADH 耦合实验系统，在 96 孔板上进行实验，实验重复进行 3 次。终反应混合物含 0.5 mg/mL 牛血清蛋白(BSA), 2 mM MnCl <sub>2</sub> , 1 mM 磷酸烯醇式丙酮酸 (PEP), 1 mM TCEP, 0.1 M HEPES 7.4, 2.5 mM 聚-[Glu4Tyr1] 肽, 1/50 终反应体积丙酮酸激酶/兔肌肉中的乳酸脱氢酶, 0.5 mM NADH, 0.5 μM EGFR 激酶, 100 μM ATP 及不同量 WZ3146。WZ3146 和 ATP 混合，从混合物中取出，与所有其他成分制作独立储液，然后加到后者中，开始反应。从 A340 曲线的斜率绘制稳态初始速度数据。
<b>细胞实验</b>	Cell lines: NSCLC 和 Ba/F3 Concentrations: 0 到 10 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 通过 MTS 实验测定生长和生长抑制情况。WZ3146 处理 NSCLC 或 Ba/F3 细胞 72 小时，测定每组实验的细胞数。所有实验点设立 6 到 8 孔，所有实验至少重复进行 3 次。使用 GraphPad Prism version 5.0 软件在 Windows 系统中绘制数据图形。使用非线性回归模型绘

制 S 型剂量反应曲线。

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。