

Pelitinib (EKB-569); 培利替尼; 贝利替尼; EKB569

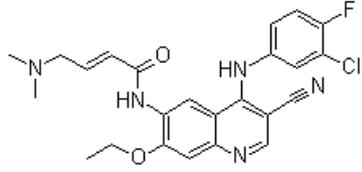
产品编号: MB7104

质量标准: >98%,不可逆 EGFR 抑制剂

包装规格: 20MG;100MG;1G

产品形式: solid

基本信息

分子式	C24H23ClFN5O2	结 构 式	
分子量	467.92		
CAS No.	257933-82-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 13 mg/mL (27.78 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: 培利替尼 Pelitinib (EKB-569;WAY-EKB 569) 是可逆的 EGFR 抑制剂。

别名: EKB-569; WAY-EKB 569; 2-Butenamide,

N-[4-[(3-chloro-4-fluorophenyl)amino]-3-cyano-7-ethoxy-6-quinolinyl]-4- (dimethylamino)-, (2E)-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 13 mg/mL (27.78 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	Pelitinib (EKB-569)是一种有效的, 不可逆 EGFR 抑制剂, IC50 为 38.5 nM。				
特性	EKI-785 的改良版。				
靶点	EGFR	Src	MEK/ERK	ErbB2	Raf
	38.5 nM	282 nM	800 nM	1.255 μM	3.353 μM
体外研究	Pelitinib 作用于 EGFR 比作用于密切相关的 c-erbB-2, 以及其他激酶, 比如 Src, Cdk4, c-Met, Raf, 和 MEK/ERK(IC50 范围为 282 nM(Src)到>20 μM(Cdk4)), 表现出更高的抑制活性。同样地, 在 A431 细胞中, Pelitinib 治疗显著抑制 EGFR 的自磷酸化, 而对 c-Met 没有作用。Pelitinib 有效抑制正常人角质细胞(NHEK), 以及 A431 和 MDA-468 肿瘤细胞的增殖, IC50 分别为 61 nM, 125 nM, 和 260 nM, 而对 MCF-7 细胞活性较低, IC50 为 3.6 μM。A431 和 NHEK 细胞中, Pelitinib 抑制 EGF 诱导的 EGFR 磷酸化, IC50 为 20-80 nM, 也会抑制 STAT3				

	的磷酸化, IC50 为 30-70 nM。75-500 nM 的 Pelitinib 也会特异性抑制 AKT 和 ERK1/2 的活化而不影响 NF-κB 通路在 NHEK 细胞中 Pelitinib 也能有效抑制 TGF-α 介导的 EGFR 活化, IC50 为 56 nM, 抑制 STAT3 和 ERK1/2 的活化, IC50 分别为 60 nM 和 62 nM。
体内研究	在过表达 EGFR 的 A431 异种移植模型中, 10 mg/kg Pelitinib 单剂量口服有效抑制 EGFR 磷酸化, 1 小时内抑制 90%, 24 小时后抑制率 > 50%。Pelitinib(20 mg/kg/day) 给药抑制 APC ^{Min/+} 小鼠体内 87% 的肿瘤发生, 相当于 2 倍剂量 EKI-785 (40 mg/kg/day) 的作用, 与较高的体内活性一致。Pelitinib 选择性抑制体内气道上皮细胞中 EGFR 信号。小鼠气道上皮细胞重构模型, 能够被病毒感染诱导, 具有延迟但永久性转变为杯状细胞化生的特点, Pelitinib(20 mg/kg/day) 治疗通过完全阻断纤毛细胞的增加和 Clara 细胞的减少, 从 3 个方面校正上皮细胞重构, 并显著抑制杯状细胞的化生。

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)

MB5614	乐伐替尼
MB5074	利尼伐尼; ABT869
MB1394	阿西替尼

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。本品培利替尼 Pelitinib (EKB-569;WAY-EKB 569) 是可逆的 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		2.1371 mL	10.6856 mL	21.3712 mL
5 mM		0.4274 mL	2.1371 mL	4.2742 mL
10 mM		0.2137 mL	1.0686 mL	2.1371 mL
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>EGFR 在细胞中的自磷酸化:</p> <p>对于体外细胞培养实验, A431 细胞用不同浓度的 Pelitinib 处理 2.75 小时, 然后与 100 ng/mL EGF 联合培养 0.25 小时。细胞用冷的磷酸缓冲盐水(PBS)洗涤 2 次, 加入裂解缓冲液(10 mM Tris, pH 7.5, 5 mM 乙二胺四乙酸(EDTA), 150 mM NaCl, 1% Triton X-100, 1% 脱氧胆酸钠, 0.1 % SDS, 1 mM PMSF, 10 mg/mL 胃酶抑素 A, 10 mg/mL 亮抑酶肽, 20 KIU/mL 抑肽酶, 2 mM 原钒酸钠, 和 100 mM 氟化钠)在冰上放置 20 分钟, 然后用于免疫沉淀反应和 SDS-PAGE-免疫印迹法。对于免疫沉淀反应, 培养的细胞放置在冷的裂解缓冲液中, 并立即在冰上通过具有几个脉冲的均质机均质化。将匀浆首先在 2500 rpm (20 分钟, 4 °C)下离心, 然后再在微型离心机(10 分钟, 4 °C)上以 14,000 rpm 离心。上清液(1000 μg 蛋白质)在 4°C 下与 15 mL EGFR 多克隆抗体培养 2 小时。2 小时后, 加入 50 μL 蛋白质 G/蛋白质 A 琼脂糖小球, 4°C 下等速旋转培养 2 小时。用裂解缓冲液洗涤后, 将珠子在 Laemmli 样品缓冲液中煮沸 2 分钟。然后蛋白质用 SDS-PAGE 分离, 转移到 Immobilon 膜上, 并用与辣根过氧化物酶(HRP)耦合的</p>
-------------	---

	抗磷酸酪氨酸抗体探测过夜。细胞膜用 ECL 试剂开发。总 EGFR 蛋白质通过剥离膜，并用受体特异性抗体重新探测确定。珠子的定量通过光密度测定法，使用 ImageQuant 软件与分子动力学激光透过扫描仪完成。
细胞实验	Cell lines: NHEK, A431, MCF-7, 和 MDA-468 Concentrations: 在 DMSO 中溶解，终浓度为~10 μM Incubation Time: 5 天 Method: 细胞接种在 96 孔板，2 小时后，加入 Pelitinib，培育 5 天。培养后，从每孔中移除培养基，加入新鲜培养基(150 μL) + 1 mg/mL MTT 溶液(50 μL)。37 °C 下培养 2 小时后，培养基用 150 μL DMSO 取代，每孔中的吸光度在 540 nm 下测定。IC50 通过数据的线性回归计算。
动物实验	Animal Models: 负荷皮下移植 A431 肿瘤的无胸腺 nu/nu 雌性小鼠，或 APCMin/+ 雄性小鼠，人类家族性腺瘤样息肉病小鼠模型(FAP) Formulation: 溶于 pH 2.0 的水中 Dosages: 10, 或 20 mg/kg/day Administration: 口服强饲

【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。