

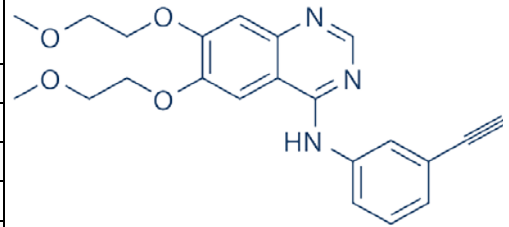
## Erlotinib (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0168-10mM	Erlotinib (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0168-5mg	Erlotinib (EGFR抑制剂)	5mg
SC0168-25mg	Erlotinib (EGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-(3-ethynylphenyl)-6,7-bis(2-methoxyethoxy)quinazolin-4-amine
简称	Erlotinib
别名	CP-358744, CP 358744, Erlotinib HCl, Erlotinib hydrochloride, Tarceva, OSI-774, OSI 774, OSI774, R-1415, R 1415, R1415, NSC 718781, 厄洛替尼, 厄罗替尼, 伊诺替尼
中文名	埃罗替尼
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>23</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>
分子量	393.44
CAS号	183321-74-6
纯度	99.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 78mg/ml; Ethanol 15mg/ml warmed
溶液配制	5mg加入1.27ml DMSO, 或每3.93mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0168-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Erlotinib是一种EGFR抑制剂, IC <sub>50</sub> 为2nM, 对EGFR的敏感性比对人c-Src或v-Ab高1000多倍。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis; JAK/STAT				
靶点	EGFR	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	2nM	—	—	—	—
体外研究	Erlotinib HCl有效抑制完整细胞, 包括HNS人头颈部肿瘤细胞(IC <sub>50</sub> 20nM), DiFi人结肠癌细胞和MDA MB-468人乳腺癌细胞中EGFR活化。Erlotinib HCl(1μM)在DiFi人结肠癌细胞中诱导细胞凋亡。Erlotinib抑制一组NSCLC细胞系, 包括A549、H322、H3255、H358、H661、H1650、H1975、H1299、H596的生长, IC <sub>50</sub> 范围为29nM到>20μM。Erlotinib HCl(2μM)显著抑制AsPC-1和BxPC-3胰细胞生长。Erlotinib HCl与gemcitabine结合使用, 在KRAS突变的胰腺癌细胞中具有协同作用。10μM Erlotinib HCl抑制Y845(Src依赖性磷酸化)和Y1068(自身磷酸化)位点的EGFR磷酸化。结合Erlotinib HCl能够下调rapamycin刺激的Akt活性, 并产生协同的细胞生长抑制作用。				
体内研究	在100mg/kg剂量下, Erlotinib HCl完全防止EGF诱导的异种移植人HN5肿瘤的无胸腺小鼠体内EGFR自身磷酸化和治疗小鼠的肝EGFR自身磷酸化。Erlotinib HCl(100mg/kg)抑制H460a和A549肿瘤模型, 分别具有71%和93%的抑制率。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	96孔板与100μl/孔0.25mg/ml PGT的PBS溶液在37°C下培养过夜进行涂层。过量PGT通过抽吸移除, 板用洗涤缓冲液(0.1% Tween 20的PBS溶液)清洗3次。激酶反应在50μl 50mM HEPES(pH7.3)中进行, 反应液中含有125mM氯化钠、24mM氯化镁、0.1mM原钒酸钠、20μM ATP、1.6μg/ml EGF和15ng从A431细胞膜亲和

	纯化的EGFR。加入Erlotinib HCl的DMSO溶液，终DMSO浓度为2.5%。磷酸化作用通过加入ATP起始，并在室温下恒定振荡进行8分钟。激酶反应通过抽吸反应混合物终止，并用洗涤缓冲液清洗4次。磷酸化的PGT通过与50µl/孔HRP偶联的PY54抗磷酸酪氨酸抗体(在封闭缓冲液(3% BSA和0.05% Tween 20的PBS溶液)中稀释为0.2µg/ml)培育25分钟进行测量。通过抽吸移除抗体，将板用洗涤缓冲液清洗4次。比色信号通过加入50µl/孔TMB微孔过氧化物酶底物产生，通过加入50µl/孔0.09M硫酸停止。磷酸酪氨酸通过测量450nm下吸光度进行估计。对照组信号通常为0.6-1.2吸收单元，没有AIP、EGFR或PGT的孔中基本上没有背景干扰，并且该信号与10分钟的培养时间成比例。
--	--

细胞实验	
细胞系	A549、H322、H3255、H358、H661、H1650、H1975、H1299、H596细胞
浓度	30nM-20µM
处理时间	72小时
方法	以指数生长的细胞以一式三份接种在96孔塑料板，并暴露于连续稀释的erlotinib、pemetrexed或4:1固定浓度比的结合物，培养72小时。细胞活性通过细胞计数和MTT法测定。生长抑制表示为药物处理组与PBS处理的对照组细胞(认为100%存活)中存活细胞的百分比。IC50值是与未处理的对照组细胞相比，在药物中暴露72小时，导致50%细胞生长抑制的浓度，通过CalcuSyn软件计算。

动物实验	
动物模型	负荷HPAC细胞的雄性5周大的BALB-nu/nu小鼠
配制	6% Captisol
剂量	50mg/kg
给药方式	口服给药

#### 参考文献：

1. Moyer JD, et al. Cancer Res. 1997; 57(21):4838-4848.
2. Higgins B, et al. Anticancer Drugs. 2004 Jun; 15(5):503-512.
3. Buck E, et al. Mol Cancer Ther. 2006; 5(11):2676-2784.
4. Li T, et al. Clin Cancer Res. 2007; 13(11):3413-3422.
5. Ali S, et al. Mol Cancer Ther. 2008; 7(6):1708-1719.
6. Furugaki K, et al. Oncol Lett. 2010; 1(2):231-235.
7. Bago-Horvath Z, et al. Neuroendocrinology. 2012; 96(3):228-37.

#### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0168-10mM	Erlotinib (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0168-5mg	Erlotinib (EGFR抑制剂)	5mg
SC0168-25mg	Erlotinib (EGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

#### 保存条件：

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

#### 注意事项：

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

#### 使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09