



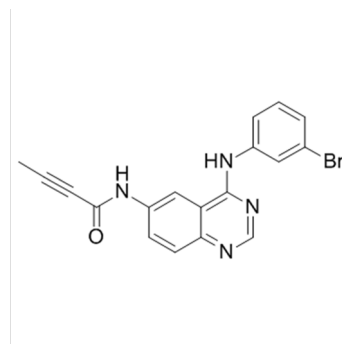
## CL-387785 (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD4785-10mM	CL-387785 (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4785-5mg	CL-387785 (EGFR抑制剂)	5mg
SD4785-25mg	CL-387785 (EGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-[4-(3-bromoanilino)quinazolin-6-yl]but-2-ynamide
简称	CL-387785
别名	EKI-785, WAY-EKI 785, CL387785, CL 387785, EK1785, WAY-EK1785, EK1 785
中文名	N/A
化学式	C <sub>18</sub> H <sub>13</sub> BrN <sub>4</sub> O
分子量	381.23
CAS号	194423-06-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 14mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.31ml DMSO, 或每3.81mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD4785-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	CL-387785 (EKI785; WAY-EKI 785) is an irreversible inhibitor of EGFR with IC <sub>50</sub> of 370+/-120pM; is able to overcome resistance caused by the T790M mutation on a functional level.				
信号通路	JAK/STAT; Protein Tyrosine Kinase				
靶点	EGFR	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	370+/-120 pM	—	—	—	—
体外研究	CL-387785 blocked EGF-stimulated autophosphorylation of the receptor in cells (IC <sub>50</sub> approximately 5nM), inhibited cell proliferation (IC <sub>50</sub> =31-125nM) primarily in a cytostatic manner in cell lines that overexpress EGF-R or c-erbB-2. Whereas transformation by most EGFR mutants confers on cells sensitivity to erlotinib and gefitinib, transformation by an exon 20 insertion makes cells resistant to these inhibitors but more sensitive to the irreversible inhibitor CL-387,785. CL-387,785 is able to overcome resistance caused by the T790M mutation on a functional level, correlating with effective inhibition of downstream signaling pathways.				
体内研究	CL-387785 profoundly blocked the growth of a tumor that overexpresses EGF-R in nude mice (when given orally at 80mg/kg/day for 10 days, daily). Treatment of BPK mice with EKI-785 resulted in a marked reduction of collecting tubule (CT) cystic lesions, improved renal function, decreased biliary epithelial abnormalities, and an increased life span. Cystic animals treated with EKI-785 to postnatal day 48 (P-48) were alive and well with normal renal function, a reduced CT cystic index of 2.0 (P<0.02), a threefold increased in maximum urinary concentrating ability (P<0.01), and a significant decrease in biliary epithelial proliferation/fibrosis (P<0.01).				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A

方法	N/A
----	-----

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Discafani CM, et al. *Biochem Pharmacol.* 1999 Apr 15, 57(8), 917-25.
2. Sweeney WE, et al. *Kidney Int.* 2000 Jan, 57(1), 33-40.
3. Greulich H, et al. *PLoS Med.* 2005 Nov, 2(11), e313.
4. Kobayashi S, et al. *Cancer Res.* 2005 Aug 15, 65(16), 7096-101.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD4785-10mM	CL-387785 (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4785-5mg	CL-387785 (EGFR抑制剂)	5mg
SD4785-25mg	CL-387785 (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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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的等效剂量转换表请参考如下网页：  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01