

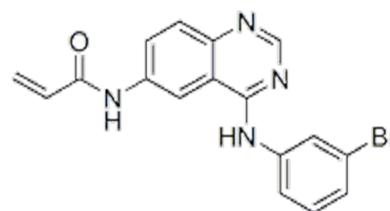
PD168393 (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5418-10mM	PD168393 (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5418-5mg	PD168393 (EGFR抑制剂)	5mg
SF5418-25mg	PD168393 (EGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[4-(3-bromoanilino)quinazolin-6-yl]prop-2-enamide
简称	PD168393
别名	Pd 168393, PD-168393
中文名	N/A
化学式	C ₁₇ H ₁₃ BrN ₄ O
分子量	369.22
CAS号	194423-15-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.35ml DMSO, 或每3.69mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5418-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	PD168393是一种不可逆的EGFR抑制剂, IC ₅₀ 为0.70nM, 不可逆烷基化Cys-773; 抑制insulin、PDGFR、FGFR和PKC活性。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis; JAK/STAT				
靶点	EGFR	Insulin Receptor	PDGFR	FGFR	PKC
IC ₅₀	0.70nM	>50μM	>50μM	>50μM	>50μM
体外研究	PD 168393连接到EGFR TK的ATP结合袋中。PD168393持续处理A431细胞, 完全抑制EGF依赖性的受体自磷酸化。PD168393作用于MDA-MB-453细胞, 抑制Heregulin诱导的酪氨酸磷酸化, IC ₅₀ 为5.7nM。PD168393抑制insulin、PDGFR、FGFR TKs和PKC活性。PD168393作用于HS-27人类成纤维细胞, 抑制EGF调节的酪氨酸磷酸化, IC ₅₀ 为1-6nM, 但对FGF或PDGF调节的酪氨酸磷酸化几乎没有作用效果。PD168393作用于3T3-Her2细胞, 快速有效抑制Her2诱导的酪氨酸磷酸化, IC ₅₀ 为~100nM。PD168393作用于3T3-Her2细胞, 也抑制PLCγ1/Stat1/Dok1/δ-catenin的磷酸化, 除了Fyb。				
体内研究	PD 168393处理携带A431人类上皮癌移植瘤的裸鼠, 抑制115%肿瘤生长, 降低50% EGFR磷酸化酪氨酸含量。PD 168393也降低血浆浓度。				
临床实验	N/A				
特征	用于设计CI-1033的临床化合物。				

➤ 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	在96孔过滤板中进行酶实验。总体积为0.1ml, 含 20mM HEPES, pH 7.4, 50μM 钒酸钠, 40mM MgCl ₂ , 含0.5μCi [³² P]ATP的10μM ATP, 20μg 聚谷氨酸/酪氨酸, 1ng EGF受体酪氨酸激酶, 及适度稀释的抑制剂和/或ATP。所有组分除了ATP加入孔中, 实验板在25°C下震荡温育10分钟。加入[³² P]ATP开始反应, 实验板在25°C下震荡温育10分钟。加入0.1ml 20% TCA终止反应, 实验板在4°C下保持至少15分钟, 使底物沉淀。使用0.125ml 10% TCA洗涤实验板五次, 使用Wallac beta酶标仪测定[³² P]摄入率。为了测评估不同的抑制类型, 通过非线性回归计算机程序拟合动力学数据。

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	携带A431人类上皮癌的裸鼠
配制	4%二甲基乙酰胺溶于水溶性50mM乳酸钠缓冲液(pH 4)
剂量	58mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Fry W, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 1998, 95(20), 12022-12027.
- 2.Bose R, et al. Proc Natl Acad Sci USA, 2006, 103(26), 9773-9778.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5418-10mM	PD168393 (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5418-5mg	PD168393 (EGFR抑制剂)	5mg
SF5418-25mg	PD168393 (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:

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当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