



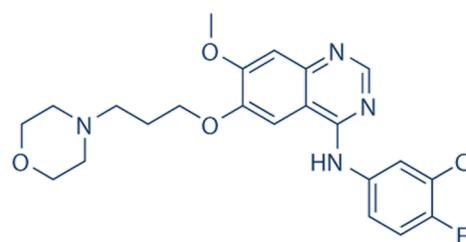
Gefitinib (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0186-10mM	Gefitinib (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0186-5mg	Gefitinib (EGFR抑制剂)	5mg
SC0186-25mg	Gefitinib (EGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-(3-chloro-4-fluorophenyl)-7-methoxy-6-(3-morpholin-4-ylpropoxy)quinazolin-4-amine
简称	Gefitinib
别名	Iressa, ZD1839, ZD 1839, ZD-1839, 吉菲替尼, 格非替尼
中文名	吉非替尼
化学式	C ₂₂ H ₂₄ ClFN ₄ O ₃
分子量	446.90
CAS号	184475-35-2
纯度	99.8%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 89mg/ml; Ethanol 4mg/ml
溶液配制	5mg加入1.12ml DMSO, 或每4.47mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0186-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Gefitinib(ZD1839)是一种EGFR抑制剂, 作用于NR6wtEGFR和NR6W细胞中的Tyr1173、Tyr992、Tyr1173和Tyr992, IC50分别为37nM、37nM、26nM和57nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis; JAK/STAT				
靶点	Tyr1173(NR6W cells)	Tyr1173(NR6wtEGFR cells)	Tyr992(NR6wtEGFR cells)	Tyr992(NR6W cells)	—
IC50	26nM	37nM	37nM	57nM	—
体外研究	Gefitinib作用于高和低表达EGFR的细胞系, 包括NR6、NR6M和NR6W细胞系, 有效抑制EGFR上全部酪氨酸磷酸化位点。磷酸化位点Tyr1173和Tyr992敏感性较低, 需要高浓度Gefitinib才能抑制。Gefitinib作用于NR6W细胞, 高效阻断PLC-γ磷酸化, IC50为27nM。NR6wtEGFR和NR6M细胞系具有低水平PLC-γ磷酸化, IC50分别为43nM和369nM。Gefitinib抑制AKT磷酸化, 作用于低EGFR和EGFRvIII表达的细胞系, IC50分别为220和263nM。Gefitinib按0.1到0.5μM剂量处理, 显著促进而不是废除NR6M细胞形成集落。然而, 2μM Gefitinib完全抑制NR6M集落形成。Gefitinib作用于高和低EGFR表达的细胞系, EGF刺激72小时后, 快速抑制EGFR和ERK磷酸化, 这种作用存在剂量依赖性。Gefitinib抑制EGF驱动的未转化MCF10A细胞生长, IC50为20nM。Gefitinib作用于MDA-MB-231细胞, 抑制EGF信号。Gefitinib严重抑制细胞数的增多, 这种作用存在剂量依赖性。				
体内研究	Gefitinib作用于无胸腺裸鼠, 抑制SKOV3或MDA-MB-231肿瘤生长。Gefitinib高效作用于两种类型肿瘤。处理14天后, MDA-MB-231肿瘤和SKOV3肿瘤生长抑制分别为71%和32%。				
临床实验	N/A				
特征	Gefitinib是有效的EGFR酪氨酸激酶抑制剂。				

➤ 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	NR6、NR6M和NR6W细胞
浓度	0μM-2μM
处理时间	72小时

方法	呈指数生长的细胞，包括NR6、NR6M、NR6M和NR6W细胞按6倍接种在96孔板上，每孔为2000个细胞，粘附，随后在PBS中清洗，然后在含0.5% FCS的培养基上温育过夜。使用不同浓度(0-2 μ M) Gefitinib或溶剂对照DMSO和EGF处理细胞。诱导NR6wtEGFR和NR6W细胞增殖的EGF最佳浓度已经测定，因此NR6wtEGFR和NR6W细胞中分别加入10nM和0.1nM EGF。NR6和NR6M细胞中不加入EGF。72小时后，通过MTT增殖检测测量细胞数。
----	--

动物实验	
动物模型	携带SKOV3或MDA-MB-231肿瘤的无胸腺裸鼠
配制	0.2% DMSO
剂量	75mg/kg
给药方式	饲喂处理

➤ **参考文献:**

- 1.Ciardello F, et al. Clin Cancer Res. 2000; 6(5):2053-2063.
- 2.Sirotnak FM, et al. Clin Cancer Res. 2000; 6(12):4885-4892.
- 3.Moasser MM, et al. Cancer Res. 2001; 61(19):7184-7188.
- 4.Williams KJ, et al. Br J Cancer. 2002; 86:1157-1161.
- 5.Pedersen MW, et al. Br J Cancer. 2005; 93(8):915-923.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0186-10mM	Gefitinib (EGFR抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC0186-5mg	Gefitinib (EGFR抑制剂)	5mg
SC0186-25mg	Gefitinib (EGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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