

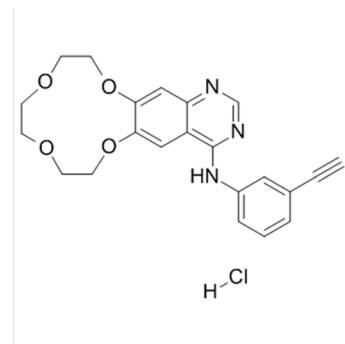
## Icotinib HCl (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD4767-10mM	Icotinib HCl (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4767-5mg	Icotinib HCl (EGFR抑制剂)	5mg
SD4767-25mg	Icotinib HCl (EGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-(3-ethynylphenyl)-7,8,10,11,13,14-hexahydro-[1,4,7,10]tetraoxacyclododecino[2,3-g]quinazolin-4-amine hydrochloride
简称	Icotinib HCl
别名	Icotinib Hydrochloride, BPI-2009H
中文名	凯美纳
化学式	C <sub>22</sub> H <sub>22</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>4</sub>
分子量	427.88
CAS号	1204313-51-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 5mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.17ml DMSO, 或每4.28mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD4767-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Icotinib hydrochloride is a potent and specific epidermal growth factor receptor (EGFR) tyrosine kinase inhibitor (TKI) with an IC <sub>50</sub> of 5nM, including its mutants of EGFR(L858R), EGFR(L861Q), EGFR(T790M) and EGFR(T790M, L858R).				
信号通路	JAK/STAT; Protein Tyrosine Kinase				
靶点	EGFR and EGFR mutants	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	5nM	—	—	—	—
体外研究	Icotinib inhibits EGFR activity in a dose-dependent manner, with an IC <sub>50</sub> value of 5nM and complete inhibition at 62.5nM. Icotinib selectively solely inhibits the EGFR members including the wild type and mutants with inhibition efficacies of 61-99%. Icotinib blocks EGFR-mediated intracellular tyrosine phosphorylation in human epidermoid carcinoma A431 cells in a dose-dependent manner. Meanwhile, in our proliferation assay performed on A431, BGC-823, A549, H460, HCT8, KB and Bel-7402 cell lines, we found that the relative sensitivity of cell lines to Icotinib is A431 > BGC-823 > A549 > H460 > KB > HCT8 and Bel-7402. Icotinib exhibits a broad spectrum of antitumor activity and it is especially effective against tumors expressing higher levels of EGFR.				
体内研究	In vivo studies demonstrated that Icotinib exhibited potent dose-dependent antitumor effects in nude mice carrying a variety of human tumor-derived xenografts. The drug was well tolerated at doses up to 120mg/kg/day in mice without mortality or significant body weight loss during the treatment. A head to head randomized, double blind phase III trial using Gefitinib as an active control for patients with advanced non-small cell lung cancer (NSCLC) was finished recently (Trial registration ID: NCT01040780).				
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. Tan F, et al. Lung Cancer. 2012 May, 76(2), 177-82.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD4767-10mM	Icotinib HCl (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4767-5mg	Icotinib HCl (EGFR抑制剂)	5mg
SD4767-25mg	Icotinib HCl (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