



碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology
 订货热线: 400-168-3301或800-8283301
 订货e-mail: order@beyotime.com
 技术咨询: info@beyotime.com
 网址: http://www.beyotime.com

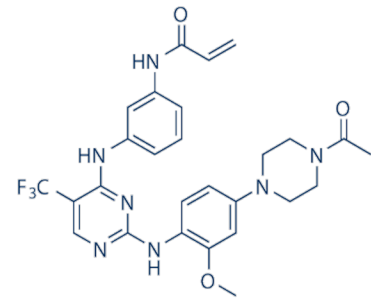
Rociletinib (EGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5323-10mM	Rociletinib (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5323-5mg	Rociletinib (EGFR抑制剂)	5mg
SF5323-25mg	Rociletinib (EGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[3-[[[2-[4-(4-acetylpiperazin-1-yl)-2-methoxyanilino]-5-(trifluoromethyl)pyrimidin-4-yl]amino]phenyl]prop-2-enamide
简称	Rociletinib
别名	CO-1686, AVL-301, UNII-72AH61702G, C ₂₇ H ₂₈ F ₃ N ₇ O ₃
中文名	N/A
化学式	C ₂₇ H ₂₈ F ₃ N ₇ O ₃
分子量	555.55
CAS号	1374640-70-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.90ml DMSO, 或每5.56mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5323-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Rociletinib (CO-1686, AVL-301)是一种不可逆的, 突变选择性EGFR抑制剂, 在无细胞试验中作用于EGFR L858R/T790M和EGFR WT, Ki分别为21.5nM和303.3nM。Phase 2。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis; JAK/STAT				
靶点	EGFR (L858R/T790M)	EGFR (wt)	—	—	—
IC50	21.5nM(Ki)	303.3nM(Ki)	—	—	—
体外研究	CO-1686抑制突变体EGFR表达的细胞中的p-EGFR, IC50的范围为62到187nM, 同时抑制EGFR磷酸化, 在三个WT EGFR表达的细胞中, IC50>2000nM。CO-1686选择性抑制NSCLC细胞表达的突变体EGFR的生长, GI50范围为7到32nM, 并诱导细胞凋亡。CO-1686抗性NSCLC细胞系表现出上皮间质转化的信号和对AKT抑制剂增加的敏感性。				
体内研究	在所有EGFR突变模型, 以及人EGFR L858R-和EGFR L858R/T790M表达的转基因小鼠体内, CO-1686引起剂量依赖性的显著的肿瘤生长抑制。				
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端GST标记的重组人野生型和T790M/L858R双重突变型EGFR, 用于测定。Omnia连续读取法根据供应商提供的方法进行。

细胞实验	
细胞系	表达突变型EGFR (HCC827, PC9, HCC827-EPR和NCI-H1975)的NSCLC细胞系和表达WT EGFR (A431, NCI-H1299和NCI-H358)的细胞系。
浓度	~10μM
处理时间	72小时
方法	细胞以3000个细胞每孔接种于生长培养基, 用5% FBS, 2mMol/L L-谷酰胺和1%青霉素-链霉素进行增殖, 使其粘附过夜, 用连续稀释的测试化合物处理72小时。细胞活性通过CellTiter-Glo测定, 并将结果

	表示为扣除背景的相对光单位，归一化为二甲基亚砜(DMSO)处理的相对值。生长抑制(GI 50)值由GraphPad Prism 5.04测定。MK-2206和XL-880化合物由Selleck化学药品得到。CI数据通过CalcuSyn产生。
--	--

动物实验	
动物模型	表达人EGFRL858R-和EGFRL858R/T790M的转基因小鼠
配制	DMSO: Solutol HS15: PBS (5:15:80; v:v:v)
剂量	~50毫克/千克
给药方式	口服灌胃

➤ 参考文献:

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5323-10mM	Rociletinib (EGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5323-5mg	Rociletinib (EGFR抑制剂)	5mg
SF5323-25mg	Rociletinib (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