

产品名称：**Olmutinib**
产品别名：奥莫替尼

生物活性:					
Description	Olmutinib (HM61713; BI-1482694) is an orally bioavailab and irreversible third EGFR tyrosine kinase inhibitor that binds to a cysteine residue near the kinase domain. Olmutinib is used for NSCLC[1][2].				
IC ₅₀ & Target	EGFR ^{Exon 19 deletion}	EGFR ^{L858R/T790M}			
	9.2 nM (IC ₅₀ , Cell Assay)	10 nM (IC ₅₀ , Cell Assay)			
In Vitro	Olmutinib potently inhibits EGFR in HCC827 cells expressing EGFRDEL19 (IC50=9.2 nM) and H1975 cells expressing EGFR ^{L858R/T790M} (IC50=10 nM). In contrast, the IC50 of olmutinib against cells expressing EGFRWT is 2225 nM[1].				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 44 mg/mL (90.43 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0551 mL	10.2756 mL	20.5512 mL
		5 mM	0.4110 mL	2.0551 mL	4.1102 mL
		10 mM	0.2055 mL	1.0276 mL	2.0551 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液。一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限 -80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。				
	In Vivo: 请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶				
	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀 向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。				
	2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中，混合均匀。				
	3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM); Clear solution				

	此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.27 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Kim ES, et al. Olmutinib: First Global Approval. <i>Drugs</i>. 2016 Jul;76(11):1153-7. [2]. Mohamed W. Attwa, et al. Detection and characterization of olmutinib reactive metabolites by LC - MS/MS: Elucidation of bioactivation pathways. <i>Journal of Separation science</i>. 18 November 2019.



源叶生物