



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

产品名称: **Canertinib**

CAS 号: **267243-28-7**

产品货号: **S87692**

生物活性:

生物活性:

Description	Canertinib (CI-1033;PD-183805) 是有效的，不可逆的 EGFR 抑制剂；抑制细胞 EGFR 和 ErbB2 自身磷酸化的 IC50 值分别为 7.4 和 9 nM。Canertinib 可以用于研究小鼠的牛痘病毒呼吸道感染。			
IC50 & Target[1]	EGFR		ErbB2	
	7.4 nM (IC50)		9 nM (IC50)	
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A-431	IC50	0.15 μM	Antiproliferative activity against human A431 cells overexpressing EGFR after 72 hrs by MTS assay
	A-431	IC50	7.4 nM	Inhibition of EGF-stimulated autophosphorylation of EGFR enzyme in A431 cells detected by immunoblotting
	A549	IC50	1.59 μM	Antiproliferative activity against human A549 cells expressing wild type EGFR coexpressing k-Ras mutant after 72 hrs by MTS assay
	A549	IC50	6 nM	Inhibition of EGF-stimulated wild type EGFR autophosphorylation expressed in human A549 cells by sandwich ELISA
	A549	IC50	7162 nM	Antiproliferative activity against human A549 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay
	BaF3	IC50	9.2 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay
	BJ	IC50	5612 nM	Cytotoxicity against human BJ cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay
	BT-474	EC50	10 nM	Antiproliferative activity against human BT474 cells overexpressing ERBb2 after 3 days by methylene blue staining
	HCC827	IC50	0.001 μM	Antiproliferative activity against human HCC827 cells harboring EGFR del E746-A750 mutant after 72 hrs by MTS assay
	HCC827	IC50	0.3776 nM	Antiproliferative activity against human HCC827 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay
	HEK-293T	IC50	6000 nM	Cytotoxicity against human HEK293T cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay
	HN5	EC50	50 nM	Antiproliferative activity against human HN5 cells overexpressing EGFR after 3 days by methylene blue staining
	L02	IC50	2.3 μM	Antiproliferative activity against human HL7702 cells expressing wilt type EGFR after 72 hrs by MTS assay
	NCI-H1975	IC50	0.064 μM	Antiproliferative activity against human NCI-H1975 cells harboring EGFR L858R/T790M mutant after 72 hrs by MTS assay
	NCI-H197	IC50	101 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H1975 cells



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	5			expressing EGFR T790M/L858R mutant incubated for 72 hrs by MTS assay	
	NCI-H1975	IC ₅₀	11.34 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H1975 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay	
	5				
	NCI-H1975	IC ₅₀	3 nM	Inhibition of EGFR L858R/T790M double mutant autophosphorylation in human NCI-H1975 cells after 2 hrs by sandwich ELISA	
	5				
	PC-9	IC ₅₀	0.8585 nM	Antiproliferative activity against human PC-9 cells assessed as inhibition of cell growth measured after 72 hrs by CCK-8 assay	
	5				
In Vitro	Canertinib 以剂量依赖性方式显著抑制培养的黑色素瘤细胞 RaH3 和 RaH5 的生长。IC50 约为 0.8 μM, 5 μM 剂量下, 两种细胞系在处理 72 小时内完全停止生长。将呈指数增长的 RaH3 和 RaH5 与 1 μM Canertinib 孵育, 可在处理后 24 小时内使细胞聚集于细胞周期的 G1 期, 且未诱导细胞凋亡。1 μM Canertinib 可抑制两种细胞系中的 ErbB1-3 受体磷酸化, 同时降低 Akt-、Erk1/2- 和 Stat3 活性[2]。 Canertinib 也是外泌体分泌的强效激活剂[3]。				
In Vivo	Canertinib 表现出优异的体内抗肿瘤活性, 口服给药后 A431 异种移植瘤的生长延迟超过 50 天 [1]。 裸鼠腹腔注射 40 mg/kg/天 Canertinib 可显著抑制人恶性黑色素瘤异种移植瘤 RaH3 和 RaH5 的生长。在治疗 4 天内, 其对黑色素瘤异种移植瘤的抗增殖作用已显现, 并且在整个治疗期间进一步增强, 这可以通过肿瘤体积的差异观察到, 并在治疗 18 天内达到统计学意义[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: Ethanol 中的溶解度 : 12.5 mg/mL (25.72 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 4.9 mg/mL (10.08 mM; 加热助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	2.0579 mL	10.2893 mL	20.5787 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4116 mL	2.0579 mL	4.1157 mL
		10 mM	0.2058 mL	1.0289 mL	2.0579 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% EtOH → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline				



	Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% EtOH $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% EtOH $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (2.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 mg/mL 的澄清 EtOH 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Smaill JB, et al. Tyrosine kinase inhibitors. 17. Irreversible inhibitors of the epidermal growth factor receptor: 4-(phenylamino)quinazoline- and 4-(phenylamino)pyrido[3,2-d]pyrimidine-6-acrylamides bearing additional solubilizing functions. J Med Chem. 2000 Apr 6;43(7):1380-97. [2]. Djurf Severinsson EA, et al. The pan-ErbB receptor tyrosine kinase inhibitor canertinib promotes apoptosis of malignant melanoma in vitro and displays anti-tumor activity in vivo. Biochem Biophys Res Commun. 2011 Oct 28;414(3):563-8. [3]. McAndrews KM, et, al. Mechanisms associated with biogenesis of exosomes in cancer. Mol Cancer. 2019 Mar 30;18(1):52. [4]. Smee DF, et, al. Progress in the discovery of compounds inhibiting orthopoxviruses in animal models. Antivir Chem Chemother. 2008;19(3):115-24.

完整储备液配制表:

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO / Ethanol	1 mM	2.0579 mL	10.2893 mL	20.5787 mL	51.4467 mL
	5 mM	0.4116 mL	2.0579 mL	4.1157 mL	10.2893 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	10 mM	0.2058 mL	1.0289 mL	2.0579 mL	5.1447 mL
Ethanol	15 mM	0.1372 mL	0.6860 mL	1.3719 mL	3.4298 mL
	20 mM	0.1029 mL	0.5145 mL	1.0289 mL	2.5723 mL
	25 mM	0.0823 mL	0.4116 mL	0.8231 mL	2.0579 mL



源叶