



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

产品名称: **Gefitinib-based PROTAC 3**

CAS 号: **2230821-27-7**

产品货号: **S88607**

生物活性:					
Description	Gefitinib-based PROTAC 3, 通过 linker 将 EGFR 结合元件与 von Hippel-Lindau 配体结合, 作用于 HCC827 (外显子 19 缺失) 和 H3255 (L858R 突变) 细胞, 诱导 EGFR 降解, DC50 分别为 11.7 nM 和 22.3 nM。				
IC50 & Target[1]	EGFR 11.7 nM (DC50, HCC827(exon 19 del) cells)	EGFR 22.3 nM (DC50, H3255 (L858R mutation) cells)	PROTAC		
In Vitro	Gefitinib-based PROTAC 3 (25 nM-10 μM; 24 h) 处理表达 L858R EGFR 的 H3255 细胞, 用 Gefitinib-based PROTAC 3 (100 nM-10 μM; 24 h) 处理表达外显子 19 del EGFR 的 HCC827 细胞, 这使得外显子 19 缺失 EGFR 以及含有 L858R 激活点突变的突变亚型的降解, 同时保留 WT EGFR[1].				
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	HCC827 cells expressing exon 19 del EGFR; H3255 cells expressing L858R EGFR			
	Concentration:	100 nM, 250 nM, 1 μM, 2.5 μM, 10 μM for HCC827 cells; 25 nM, 100 nM, 1 μM, 2.5 μM, 10 μM for H3255 cells			
	Incubation Time:	24 hours			
	Result:	Degradation of both exon-19 deletion EGFR as well as the mutant isoform containing the L858R activating point mutation.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 60 mg/mL (64.20 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.0701 mL	5.3504 mL	10.7008 mL
		5 mM	0.2140 mL	1.0701 mL	2.1402 mL
		10 mM	0.1070 mL	0.5350 mL	1.0701 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
	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% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (2.68 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (2.68 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 0.83 mg/mL (0.89 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.83 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 8.3 mg/mL 的澄清 DMSO 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。
参考文献	[1]. Burslem GM, et al. The Advantages of Targeted Protein Degradation Over Inhibition: An RTK Case Study. Cell Chem Biol. 2018 Jan 18;25(1):67-77.e3.

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° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.0701 mL	5.3504 mL	10.7008 mL	26.7520 mL
	5 mM	0.2140 mL	1.0701 mL	2.1402 mL	5.3504 mL
	10 mM	0.1070 mL	0.5350 mL	1.0701 mL	2.6752 mL
	15 mM	0.0713 mL	0.3567 mL	0.7134 mL	1.7835 mL
	20 mM	0.0535 mL	0.2675 mL	0.5350 mL	1.3376 mL
	25 mM	0.0428 mL	0.2140 mL	0.4280 mL	1.0701 mL
	30 mM	0.0357 mL	0.1783 mL	0.3567 mL	0.8917 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

	40 mM	0.0268 mL	0.1338 mL	0.2675 mL	0.6688 mL
	50 mM	0.0214 mL	0.1070 mL	0.2140 mL	0.5350 mL



源叶