



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: **EGFR-IN-7**
CAS 号: **2267329-76-8**
产品货号: **S89109**

生物活性:				
Description	EGFR-IN-7 是一种有效的选择性 EGFR 激酶抑制剂,具有口服活性。EGFR-IN-7 对 EGFR (WT) 和 EGFR (突变体 C797S/T790M/L858R) 具有抑制作用, IC50 值分别为 7.92 nM 和 0.218 nM。EGFR-IN-7 可用于各种癌症的研究。			
IC50 & Target[1]	EGFR (WT) 7.92 nM (IC50)		EGFR (C797S/T790M/L858R) 0.218 nM (IC50)	
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BaF3	IC50	17 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells expressing EGFR deletion19/T790M/C797S mutant assessed as reduction on cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	BaF3	IC50	21 nM	Antiproliferative activity against mouse BaF3 cells expressing EGFR L858R/T790M/C797S mutant assessed as reduction on cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	NCI-H1975	IC50	910 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H1975 cells expressing EGFR L858R/T790M/C797S mutant assessed as reduction on cell growth incubated for 72 hrs by MTT assay
	PC-9	IC50	45 nM	Antiproliferative activity against human PC-9 cells expressing EGFR deletion19/T790M/C797S mutant assessed as reduction on cell growth growth incubated for 72 hrs by MTT assay
In Vitro	EGFR-IN-7 (化合物 34) (10 mM) 对 EGFR (WT)、EGFR (Δ 19del/T790M/C797S) 和 EGFR (C797S/T790M/L858R) 的酶活性有很强的抑制作用, IC50 值分别为 7.92 nM、0.218 nM 和 0.16 nM[1]。			
	EGFR-IN-7 (1 mM) 在 A431 细胞中对 EGFR (WT) 有很好的选择性, IC50 值为 154 nM[1]。			
	EGFR-IN-7 (10 μ M-0.508 nM) 对 Ba/F 3 (EGFR Δ 19del/T790M/C797S) 三重突变体的 IC50 值为 22 nM[1]。			
	EGFR-IN-7 (10 μ M 或 100 μ M) 可抑制 pEGFR Ba/F 3 (EGFR Δ 19del/T790M/C797S) 细胞的磷酸化活性, IC50 值为 19 nM[1]。			
	Cell Proliferation Assay[1]			
	Cell Line:		A431 cells; Ba/F 3 (EGFRΔ19del/T790M/C797S) suspension cells	
	Concentration:		1 mM; 10 μM-0.508 nM	
In Vivo	Incubation Time:		3 days	
	Result:		Inhibited proliferation in cells	
	EGFR-IN-7 (化合物 34; 5-45 mg/kg; 口服; 每日一次; 共 13 天) 在皮下植入 Ba/F 3 (Δ 19del/T790M/C797S) 衍生的异种移植 (CDX) BALB/c 裸鼠耐药模型中表现出强效的抗肿瘤活性[1]。			
	EGFR-IN-7 (25 和 50 mg/kg; 口服; 每日一次, 共 3 周) 对小鼠皮下异种移植 PC-9 (Δ 19del) 模型中的肿瘤生长有显著的抑制作用[1]。			
	Animal Model:		Ba/F 3 (Δ19del/T790M/C797S)-derived xenograft (CDX) BALB/c nude mice (female, 6-8 weeks, 18-22 g)[1]	
Dosage:		5, 15, 45 mg/kg		
Administration:		Oral administration, daily, for 13 days		



	<table><tr><td>Result:</td><td>Significantly increased the half-life, the amount of exposure in plasma and tissues, had good pharmacokinetic effects in mice.</td></tr><tr><td>Animal Model:</td><td>Subcutaneous xenograft PC-9 (Δ19del) model[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>0-9 days: 50 mg/kg, 10-21 days: 25 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Oral administration, once a day, 3 weeks</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Had a significant inhibitory effect on tumor growth, had a tumor-reducing effect and showed good antitumor efficacy.</td></tr></table>	Result:	Significantly increased the half-life, the amount of exposure in plasma and tissues, had good pharmacokinetic effects in mice.	Animal Model:	Subcutaneous xenograft PC-9 (Δ19del) model[1]	Dosage:	0-9 days: 50 mg/kg, 10-21 days: 25 mg/kg	Administration:	Oral administration, once a day, 3 weeks	Result:	Had a significant inhibitory effect on tumor growth, had a tumor-reducing effect and showed good antitumor efficacy.
Result:	Significantly increased the half-life, the amount of exposure in plasma and tissues, had good pharmacokinetic effects in mice.										
Animal Model:	Subcutaneous xenograft PC-9 (Δ19del) model[1]										
Dosage:	0-9 days: 50 mg/kg, 10-21 days: 25 mg/kg										
Administration:	Oral administration, once a day, 3 weeks										
Result:	Had a significant inhibitory effect on tumor growth, had a tumor-reducing effect and showed good antitumor efficacy.										
Solvent&Solubility	细胞实验:										
	DMSO 中的溶解度 : 5 mg/mL (7.20 mM); ultrasonic and warming and adjust pH to 5 with 0.1 M HCL and heat to 60°C; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)										
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg						
		1 mM	1.4397 mL	7.1984 mL	14.3968 mL						
		5 mM	0.2879 mL	1.4397 mL	2.8794 mL						
		10 mM	---	---	---						
	*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. -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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline										
	Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (1.80 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 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 ddH ₂ O 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% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)											
Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (1.80 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 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水电溶液 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											



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

	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 1.25 mg/mL (1.80 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 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Ling WY, et. al. Prostaglandin E2 suppresses bacterial killing in alveolar macrophages by inhibiting NADPH oxidase.

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。 -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	1.4397 mL	7.1984 mL	14.3968 mL	35.9919 mL
	5 mM	0.2879 mL	1.4397 mL	2.8794 mL	7.1984 mL