



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: **Theliatinib**
CAS 号: **1353644-70-8**
产品货号: **T27240**

生物活性:

Description	Theliatinib (Xilertinib) is a potent, ATP-competitive, orally active and highly selective EGFR inhibitor with a Ki of 0.05 nM and an IC50 of 3 nM. Theliatinib has an IC50 of 22 nM for EGFR T790M/L858R mutant. Theliatinib shows >50-fold selectivity for EGFR than other kinases[1]. Theliatinib is a click chemistry reagent, it contains an Alkyne group and can undergo copper-catalyzed azide-alkyne cycloaddition (CuAAC) with molecules containing Azide groups.				
IC50 & Target	EGFR 3 nM (IC50)	EGFR 0.05 nM (Ki)	EGFR (L858R/T790M) 22 nM (IC50)		
In Vitro	Theliatinib 显著抑制 A431 细胞中的 EGFR 磷酸化,IC50 为 7 nM。Theliatinib 还抑制 A431、H292 和 FaDu 细胞存活, IC50 值分别为 80 nM、58 nM 和 354 nM[1]。				
In Vivo	Theliatinib 显著抑制 A431 细胞中的 EGFR 磷酸化,IC50 为 7 nM。Theliatinib 还抑制 A431、H292 和 FaDu 细胞存活, IC50 值分别为 80 nM、58 nM 和 354 nM[1]。 Animal Model: NOD-SCID mice injected with esophageal cancer cells (PDECX 1T0950 model)[1] Dosage: 2 mg/kg, 5 mg/kg, 15 mg/kg Administration: Oral administration;daily; for 21 days Result: Attenuated tumor growth in PDECX 1T0950 model in a dose-dependent manner.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 1 mg/mL (2.26 mM; 超声助溶 (<60 °C); 酸性条件溶解 (HCl 调节, pH≈3); 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	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.2598 mL	11.2992 mL	22.5984 mL
		5 mM	---	---	---
		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, 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。					
参考文献	[1]. Ren Y, et al. Anti-tumor efficacy of theliatinib in esophageal cancer patient-derived xenografts models with epidermal growth factor receptor (EGFR) overexpression and gene amplification. Oncotarget. 2017 Apr 19;8(31):50832-50844.				