



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: **HKI 357**
CAS 号: **848133-17-5**
产品货号: **T68959**

生物活性:

Description	HKI-357 is an irreversible dual inhibitor of EGFR and ERBB2 with IC50s of 34 nM and 33 nM, respectively. HKI-357 suppresses EGFR autophosphorylation (at Y1068), and AKT and MAPK phosphorylation[1].				
IC50 & Target	EGFR	ErbB2			
	34 nM (IC ₅₀)	33 nM (IC ₅₀)			
In Vitro	HKI-357 (0.01-10 μM) is effective in suppressing ligand-induced EGFR autophosphorylation and its downstream signaling, as determined by AKT and MAPK phosphorylation in NCI-H1975 cells[1]. HKI-357 also is effective in suppressing EGFR autophosphorylation (measured at residue Y1068), and AKT and MAPK phosphorylation in parental NCI-H1650 cells harboring the delE746-A750 EGFR mutation[1]. Cell Line: NCI-H1975 bronchoalveolar cell line Concentration: 0.01, 0.01, 0.1, 1 and 10 μM Incubation Time: Result: Suppressed ligand-induced EGFR autophosphorylation and its downstream signaling AKT and MAPK phosphorylation.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (174.20 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.7420 mL	8.7100 mL	17.4201 mL
		5 mM	0.3484 mL	1.7420 mL	3.4840 mL
		10 mM	0.1742 mL	0.8710 mL	1.7420 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。-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: ≥ 2.5 mg/mL (4.36 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。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (4.36 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.36 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。
参考文献	[1]. Kwak EL, et al. Irreversible inhibitors of the EGF receptor may circumvent acquired resistance to gefitinib. Proc Natl Acad Sci U S A. 2005 May 24;102(21):7665-70.

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	1.7420 mL	8.7100 mL	17.4201 mL	43.5502 mL
	5 mM	0.3484 mL	1.7420 mL	3.4840 mL	8.7100 mL
	10 mM	0.1742 mL	0.8710 mL	1.7420 mL	4.3550 mL
	15 mM	0.1161 mL	0.5807 mL	1.1613 mL	2.9033 mL
	20 mM	0.0871 mL	0.4355 mL	0.8710 mL	2.1775 mL
	25 mM	0.0697 mL	0.3484 mL	0.6968 mL	1.7420 mL
	30 mM	0.0581 mL	0.2903 mL	0.5807 mL	1.4517 mL
	40 mM	0.0436 mL	0.2178 mL	0.4355 mL	1.0888 mL
	50 mM	0.0348 mL	0.1742 mL	0.3484 mL	0.8710 mL
	60 mM	0.0290 mL	0.1452 mL	0.2903 mL	0.7258 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

	80 mM	0.0218 mL	0.1089 mL	0.2178 mL	0.5444 mL
	100 mM	0.0174 mL	0.0871 mL	0.1742 mL	0.4355 mL



源叶