

Canertinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Canertinib	53797ES10	10 mg
	53797ES50	50 mg

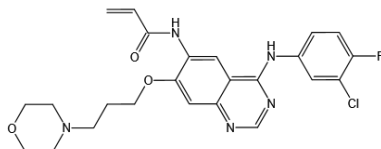
产品描述

Canertinib (CI-1033, PD183805), 又称卡奈替尼, 是可口服、不可逆的 ErbB 抑制剂, 通过不可逆地结合 ErbB 家族中 TK 结构域的 ATP 口袋发挥作用, 作用于 EGFR 和 ErbB2 的 IC_{50} 值为 7.4 nM 和 9 nM, 具有潜在抗癌活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Canertinib, CI-1033, PD183805
中文名称 (Chinese Name)	卡奈替尼
靶点 (Target)	ErbB
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	267243-28-7
分子式 (Formula)	$C_{24}H_{25}ClFN_5O_3$
分子量 (Molecular Weight)	485.94
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C, 有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

Canertinib 以剂量依赖性方式抑制黑素瘤细胞 RaH3 和 RaH5 的生长; Canertinib (1 μ M) 抑制 ErbB1-3 受体磷酸化, 降低

Akt、Erk1/2 和 Stat3 活性。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

在 RaH3 和 RaH5 异种移植瘤小鼠模型中，腹腔注射 Canertinib (40 mg/kg)显著抑制瘤体生长。^[2]

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]. Djerf 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.