

Crizotinib（克里唑替尼）

产品信息

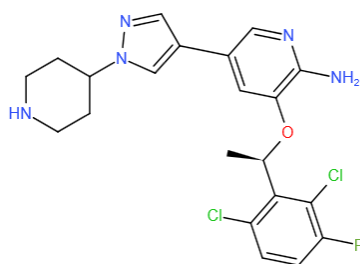
产品名称	产品编号	规格
Crizotinib（克里唑替尼）	52726ES10	10 mg
	52726ES50	50 mg

产品描述

Crizotinib（克里唑替尼）是一种有效的针对 ALK（间变淋巴瘤激酶）、ROS1 和另一个癌基因受体酪氨酸激酶 MET 的小分子酪氨酸激酶抑制剂(TKI)，其对 c-Met 和 ALK 的 IC_{50} 分别是 11 nM 和 24 nM。Crizotinib（克里唑替尼）可在多种肺癌细胞系中通过抑制 STAT3 信号通路来诱导细胞自噬，常用于间变性淋巴瘤激酶(ALK)阳性的局部晚期或转移性非小细胞肺癌(NSCLC)患者的治疗。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	3-[(1R)-1-(2,6-Dichloro-3-fluorophenyl)ethoxy]-5-[1-(piperidin-4-yl)-1H-pyrazol-4-yl]-2-aminopyridine; PF 2341066; PF-02341066; PF02341066
中文名称 (Chinese Name)	3-[(R)-1-(2,6-二氯-3-氟苯基)乙氧基]-5-[1-(哌啶-4-基)-1H-吡唑-4-基]吡啶-2-胺
靶点 (Target)	c-Met; ALK; ROS1
CAS 号 (CAS NO.)	877399-52-5
分子式 (Formula)	$C_{21}H_{22}Cl_2FN_5O$
分子量 (Molecular Weight)	450.34
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 95\%$
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℃，有效期 2 年。建议分装后-20℃避光保存，避免反复冻融。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
- 3) 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）

Crizotinib（克里唑替尼）分别处理 MP 细胞系和 LLC SP 细胞系 12 h，其检测数据 IC_{50} 值分别是 21.3 nM 和 22.4 nM，SP 细胞在 crizotinib 处理后没有显著变化，但当 crizotinib 与 verapamil 联合作用 SP 细胞系时，SP 细胞显示出 $50.0 \pm 0.6\%$ 的细胞存活率，而 crizotinib (22.4 nM) 单独作用时，SP 细胞的存活率为 $105.3 \pm 0.4\%$ ，数据显示 crizotinib 呈现浓度和时间依赖性的抑制 MP 细胞和 SP 细胞的生长。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

Crizotinib（克里唑替尼）（100 mg/kg，口服给药）每天处理携带 Karpas299 ALCL 移植瘤的 SCID Beige 小鼠，15 天后，肿瘤完全消退，Crizotinib 这种高效抑癌活性，呈现剂量依赖性。^[2]

参考文献

- [1]. Xia P, et al. Crizotinib may be used in lewis lung carcinoma: A novel use for crizotinib[J]. Oncology reports, 2013, 30(1): 139-148.
- [2]. Christensen JG, et al. Cyto-reductive antitumor activity of PF-2341066, a novel inhibitor of anaplastic lymphoma kinase and c-Met, in experimental models of anaplastic large-cell lymphoma. Mol Cancer Ther. 2007 Dec;6(12 Pt 1):3314-22.
- [3]. Cullinane C, et al. Differential (18)F-FDG and 3'-deoxy-3'-(18)F-fluorothymidine PET responses to pharmacologic inhibition of the c-MET receptor in preclinical tumor models. J Nucl Med. 2011 Aug;52(8):1261-7.