

Afatinib 阿法替尼

产品信息

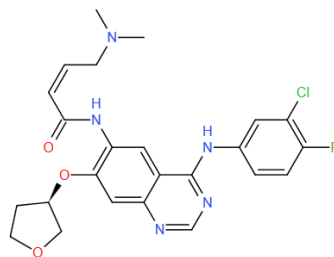
产品名称	产品编号	规格
	52705ES10	10 mg
Afatinib 阿法替尼	52705ES50	50 mg
	52705ES60	100 mg

产品描述

Afatinib (阿法替尼, 又称 BIBW2992, BIBW-2992) 是一种不可逆的 ErbB 家族抑制剂, 抑制 EGFR1 和 HER2, 其 IC₅₀ 值分别为 0.5 nM 和 14 nM。在一系列过表达 EGFR 和表达 HER2 细胞中, 如 A431, NIH-3T3-HER2, NCI-N87 和 BT-474, Afatinib 可以抑制 EGF 诱导的 EGFR 磷酸化和细胞增殖。另外, Afatinib 抑制癌细胞生长和存活, 并诱导异种移植瘤和转基因肺癌模型中的肿瘤衰退, 其活性优于 erlotinib。Afatinib 已被批准用于治疗 EGFR 突变的非小细胞肺癌患者。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	(S,E)-N-(4-(3-chloro-4-fluorophenylamino)-7-(tetrahydrofuran-3-yloxy)quinazolin-6-yl)-4-(dimethylamino)but-2-enamide; BIBW-2992; BIBW 2992; Tomtovok
中文名称 (Chinese Name)	阿法替尼; N-[4-[(3-氯-4-氟苯基)氨基]-7-[[[3S]-四氢-3-呋喃基]氧基]-6-喹唑啉基]-4-(二甲基氨基)-2-丁烯酰胺
靶点 (Target)	EGFR; HER2
CAS 号 (CAS NO.)	439081-18-2
分子式 (Formula)	C ₂₄ H ₂₅ ClFN ₅ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	485.94
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	易溶于 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 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C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）

为检测 Afatinib 对细胞的作用，用不同浓度 Afatinib (0 - 10000 nM) 孵育 NIH-3T3 细胞，Afatinib 在有效软琼脂上抑制克隆形成，其作用方式为剂量依赖型，而且 Afatinib 抑制 EGFR 磷酸化蛋白表达。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

为研究 Afatinib 在体内的抗肿瘤活性，Afatinib (25 mg/kg; 口服给药) 处理 A431 移植瘤小鼠，结果显示实验组小鼠出现明显的肿瘤衰退，并且免疫组化结果显示，小鼠组织 EGFR 和 AKT 磷酸化水平下调。^[1]

参考文献

[1] Li, D., et al. BIBW2992, an irreversible EGFR/HER2 inhibitor highly effective in preclinical lung cancer models. *Oncogene* 27: 4702-4711 (2008).