

WZ8040

产品信息

产品名称	产品编号	规格
WZ8040	53451ES08	5 mg

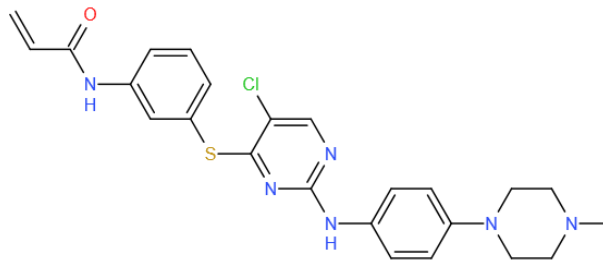
产品描述

WZ8040 (WZ-8040)是一种新型的突变体选择性 EGFR 抑制剂, 特异性地抑制 EGFR T790M 的磷酸化, 抑制含有 EGFR T790M 的细胞系的生长, 同时抑制非小细胞肺癌(NSCLC)细胞 EGFR 的磷酸化。WZ8040 可有效抑制 HCC827 (EGFR Del E746_A750) ($IC_{50}=1$ nM)、PC9 (EGFR Del E746_A750) ($IC_{50}=6$ nM)、H3255 (EGFR L858R) ($IC_{50}=66$ nM)、H1975 (EGFR L858R/T790M) ($IC_{50}=9$ nM) 和 PC9 GR (EGFR Del E746_A750/T790M) ($IC_{50}=8$ nM) 的生长。WZ8040 微弱抑制 HCC827 GR (EGFR E746_A750/MET amp) ($IC_{50}>3.3$ μ M)、H1819 (ERBB2 amp) ($IC_{50}=738$ nM)、Calu-3 (ERBB2 amp) ($IC_{50}=915$ nM)、H1781 (ERBB2 Ins G776V, C) ($IC_{50}=744$ nM) 和 HN11 (EGFR & ERBB2 野生型) ($IC_{50}=1.82$ μ M) 的生长。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	WZ-8040; WZ 8040
中文名称 (Chinese Name)	EGFR T790M 抑制剂
靶点 (Target)	EGFR T790M
通路 (Pathway)	JAK/STAT-EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	1214265-57-2
分子式 (Formula)	$C_{24}H_{25}ClN_6OS$
分子量 (Molecular Weight)	481.01
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

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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）

细胞实验（体外实验）

WZ8040 对突变体 EGFR T790M 的抑制效果远高于野生型 EGFR，对 EGFR T790M 的抑制效果是间二氮杂萘类 EGFR 抑制剂如 CL-387785、HKI-272 的 30-100 多倍，对野生型 EGFR 的抑制效果则比间二氮杂萘类 EGFR 抑制剂低 100 倍。WZ8040 可有效抑制 HCC827 (EGFR Del E746_A750) ($IC_{50}=1$ nM)、PC9 (EGFR Del E746_A750) ($IC_{50}=6$ nM)、H3255 (EGFR L858R) ($IC_{50}=66$ nM)、H1975 (EGFR L858R/T790M) ($IC_{50}=9$ nM) 和 PC9 GR (EGFR Del E746_A750/T790M) ($IC_{50}=8$ nM) 的生长。WZ8040 微弱抑制 HCC827 GR (EGFR E746_A750/MET amp) ($IC_{50}>3.3$ μ M)、H1819 (ERBB2 amp) ($IC_{50}=738$ nM)、Calu-3 (ERBB2 amp) ($IC_{50}=915$ nM)、H1781 (ERBB2 Ins G776V, C) ($IC_{50}=744$ nM) 和 HN11 (EGFR & ERBB2 野生型) ($IC_{50}=1.82$ μ M) 的生长。WZ8040 (~10 μ M) 对 A549 (KRAS 突变体) 或 H3122 (EML4-ALK) 细胞都是无毒副作用的。^[1]

参考文献

[1] Zhou W, Ercan D, et al. Novel mutant-selective EGFR kinase inhibitors against EGFR T790M. Nature. 2009 Dec 24;462(7276):1070-4.