

HB221111

Varlitinib

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Varlitinib	53454ES08	5 mg

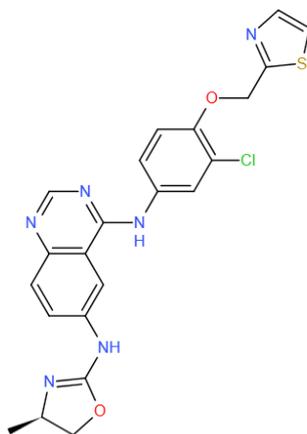
产品描述

Varlitinib (ASLAN001; ARRY-334543; ARRY334543)是有效的 EGFR 抑制剂, 高效抑制 HER2 活性 (IC₅₀=2 nM)。Varlitinib 是 AKT 抑制剂, 抑制含活跃 ErbB-2 受体的细胞。Varlitinib 作用于人癌细胞, 如过量表达 ErbB-2 的 BT-474 细胞和过量表达 ErbB-1 的 A431 细胞, 抑制 ErbB-2 和 ErbB-1 磷酸化, 其 IC₅₀ 值分别为 43 nM 和 36 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	ASLAN001; ARRY-334543; ARRY334543
中文名称 (Chinese Name)	ErbB 抑制剂
靶点 (Target)	HER1; HER2; HER4
通路 (Pathway)	JAK/STAT-EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	845272-21-1
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₁₉ ClN ₆ O ₂ S
分子量 (Molecular Weight)	466.94
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥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℃, 有效期 3 年。建议分装后-20℃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）

（一）细胞实验（体外实验）

Varlitinib 是可逆的 ATP 竞争性抑制剂， $K_i=1$ nM。Varlitinib 是 AKT 抑制剂，抑制含活跃 ErbB-2 受体的细胞。Varlitinib 作用于人癌细胞，如过量表达 ErbB-2 的 BT-474 细胞和过量表达 ErbB-1 的 A431 细胞，抑制 ErbB-2 和 ErbB-1 磷酸化，其 IC_{50} 值分别为 43 nM 和 36 nM。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

Varlitinib（25, 50, 100 mg/kg；口服；每隔一天处理一次；持续 21 天）作用于过量表达肿瘤 A431 的移植瘤鼠，可明显抑制肿瘤生长。^[2]

参考文献

[1] Miknis G, et al. ARRY-334543, A potent, orally active small molecule inhibitor of EGFR and ErbB-2. Proc Amer Assoc Cancer Res, Volume 46, 2005

[2] Hsieh C, et al. Varlitinib to demonstrate anti-tumour efficacy in patient-derived hepatocellular carcinoma xenograft models. Journal of Clinical Oncology 34, no. 15_suppl.