

Osimertinib 奥希替尼

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Osimertinib 奥希替尼	53534ES10	10 mg
	53534ES50	50 mg

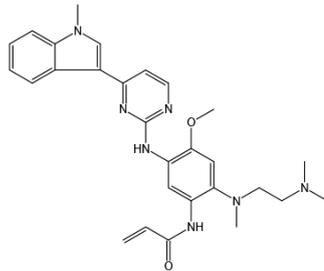
产品描述

Osimertinib (AZD9291, Mereletinib, AZD-9291), 又称奥希替尼或奥斯替尼, 第三代 EGFR 抑制剂, 是口服不可逆的突变型 EGFR 选择性抑制剂, 作用于 EGFR L858R 和 EGFR L858R/T790M 的 IC_{50} 分别为 12 和 1 nM。EGFR 的突变会引起肿瘤的药物耐受性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Osimertinib, AZD9291, Mereletinib, AZD-9291
中文名称 (Chinese Name)	奥希替尼, 奥斯替尼
靶点 (Target)	EGFR L858R, EGFR L858R/T790M
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	1421373-65-0
分子式 (Formula)	$C_{28}H_{33}N_7O_2$
分子量 (Molecular Weight)	499.61
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）

Osimertinib (0-10 μ M)抑制 Ba/F3 (EGFR T790M, EGFR exon 19 deletion+T790M, EGFR L858R+T790M)细胞活性, IC₅₀ 值为 6、7、74 nM。Osimertinib (0.1 μ M)诱导 Ba/F3 细胞凋亡(EGFR exon 19 deletion+T790M 凋亡率 40.9%, EGFR L858R+T790M 凋亡率 90%)。 [2]

（二）动物实验（体内实验）

在 PC9 (ex19del)和 H1975 (L858R/T790M)移植瘤小鼠模型中, 给药 Osimertinib (1-25 mg/kg)抑制肿瘤生长, 抑制体内 EGFR 磷酸化和下游关键信号通路。 [1]

参考文献

- [1]. Cross DA, et al. AZD9291, an irreversible EGFR TKI, overcomes T790M-mediated resistance to EGFR inhibitors in lung cancer. *Cancer Discov.* 2014 Sep;4(9):1046-61.
- [2]. Gidding, C.E., et al, Vincristine revisited. *Crit Rev Oncol Hematol*, 1999. 29(3): p. 267-87.