

Gefitinib (ZD1839) 吉非替尼

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Gefitinib (ZD1839, Iressa) 吉非替尼	52717ES60	100 mg
	52717ES76	500 mg

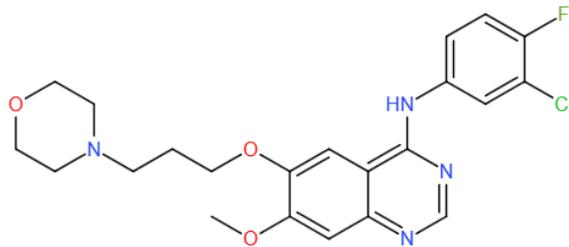
产品描述

Gefitinib 是一种有效的表皮生长因子受体(EGFR)抑制剂,其在 NR6wtEGFR 细胞中的 IC₅₀ 值为 2-37 nM。Gefitinib 与 EGFR 的 ATP 结合,抑制 EGFR 酪氨酸激酶活性和 EGFR 通路。Gefitinib 还可以抑制细胞增殖,诱导细胞凋亡,具有抗血管生成活性,在多种肿瘤中具有抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Gefitinib; ZD1839
中文名称 (Chinese Name)	吉非替尼
靶点 (Target)	EGFR
通路 (Pathway)	JAK/STAT--EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	184475-35-2
分子式 (Formula)	C ₂₂ H ₂₄ ClFN ₄ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	446.90
外观 (Appearance)	固体粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	易溶于 DMSO: ≥50mg/mL

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C,保持干燥,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。

溶解使用方式

体外:使用 DMSO 溶解,溶解度为≥30 mg/mL (67.13 mM)

体内：1、吉非替尼用载体（玉米油+5%DMSO）制备^[1]

2、将吉非替尼溶解于由 DMSO, PEG400 和蒸馏水（5:45:50%, v/v/v）组成的体系内制备浓度为 1 mg/mL 溶液^[2]

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）

将细胞接种到 96 孔板中，使用吉非替尼（0.01-20 μM ），二甲双胍或两者处理 72 小时，用 MTT 或 CCK-8 测量细胞增殖情况，通过剂量-反应曲线的插值确定 IC_{50} 值。结果表示 3 个单独实验的中值，每个实验一式四份进行，通过使用 CalcuSyn 软件程序，根据 Chou 和 Talalay 方法分析组合处理的结果。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

在注射癌细胞之前，将 4 到 6 周龄雌性 BALB/c 无胸腺 (NU+/NU+) 小鼠驯化 1 周，将 1×10^7 个 H1299 和 CALU-3 GEF-细胞重悬在 200 微升 Matrigel 中并皮下注射。当检测到直径约 75 mm^3 的实体瘤时，小鼠不进行治疗或口服二甲双胍（稀释二甲双胍 200 mg/mL 于饮用水中并在整个实验中存在），吉非替尼（按 150 mg/kg 每天口服灌胃）或在指定时间段内的服用二者。每个治疗组由 10 只小鼠组成，使用公式 $\pi/6 \times \text{较大直径} \times (\text{较小直径})^2$ 测量肿瘤体积。^[3]

将大鼠随机分配到 4 个实验组别：1）每天一次对未照射的大鼠口服给予载体（0.1%温 80）治疗；2）每天一次对未照射的大鼠口服吉非替尼（50 mg/kg/天）治疗；3）每天一次对受照射的大鼠口服给药治疗；4）每天一次对受照射的大鼠口服吉非替尼治疗。每个实验组包含 5-6 只大鼠，并且所有处理组都被治疗 14 天。^[4]

参考文献

[1] Dhar D, et al. Liver Cancer Initiation Requires p53 Inhibition by CD44-Enhanced Growth Factor Signaling. *Cancer Cell*. 2018 Jun 11;33(6):1061-1077.e6.

[2] Noh CK, et al. Simultaneous quantification of volitinib and gefitinib in rat plasma by HPLC-MS/MS for application to a pharmacokinetic study in rats. *J Sep Sci*. 2017 Jul 27.

[3] Morgillo F, et al. Synergistic effects of metformin treatment in combination with gefitinib, a selective EGFR tyrosine kinase inhibitor, in LKB1 wild-type NSCLC cell lines. *Clin Cancer Res*. 2013 Jul 1;19(13):3508-19.

[4] Miyake K, et al. Epidermal growth factor receptor-tyrosine kinase inhibitor (gefitinib) augments pneumonitis, but attenuates lung fibrosis in response to radiation injury in rats. *J Med Invest*. 2012;59(1-2):174-85.