

Catalog Number: CM01912

产品信息

Catalog Number:
CM01912

CAS号:
2326521-71-3

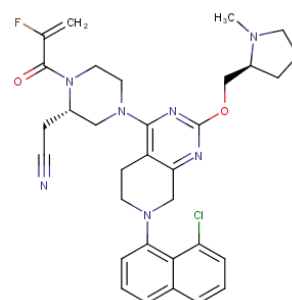
分子式:
 $C_{32}H_{35}ClFN_7O_2$

主要靶点:
Ras

主要通路:
MAPK 信号通路|G 蛋白偶联受体

分子量:
604.12

溶解度:
DMSO:60 mg/mL (99.32 mM); 10% DMSO+40% PEG300+5% Tween 80+45% Saline:10 mg/mL (16.55 mM)



体外活性

方法: 17 个 KRAS G12C 突变体和 3 个非 KRAS G12C 突变体肿瘤细胞用 Adagrasib (0-10 μ M) 处理 3 天, 使用 CellTiter-Glo assay 检测 2D 培养的细胞活力。结果: MRTX849 在绝大多数 KRAS G12C 突变细胞系中有效抑制细胞生长, IC₅₀ 值在 10-973 nM。三个非 KRAS G12C 突变细胞的 IC₅₀ 值大于 1 μ M。[1] 方法: 人肺细胞 NCI-H358 用 Adagrasib 处理 3 h, 使用 Cell-Based Phospho-ERK Assay 检测靶点抑制活性。结果: Adagrasib 抑制 NCI-H358 的 p-ERK 水平, IC₅₀ 为 14 nM。[2]

体内活性

方法: 为检测体内抗肿瘤活性, 将 Adagrasib (1-100 mg/kg, 10% Captisol in 10 mM citrate buffer pH 5.0) 灌胃给药给携带人胰腺癌肿瘤 MIA PaCa-2 或人肺腺癌肿瘤 H358 的 athymic nude 小鼠, 每天一次, 持续 16-22 天。结果: MRTX849 在耐受性良好的剂量范围内表现出剂量依赖性抗肿瘤疗效。[1] 方法: 为检测体内抗肿瘤活性, 将 Adagrasib (30 mg/kg, 口服给药) 和 paclitaxel (18 mg/kg, 腹腔注射) 给药给携带 ABCB1 介导的 MDR 异种植物肿瘤的 athymic nude 小鼠, 每三天一次, 持续四周。结果: 肿瘤对 Adagrasib 和 paclitaxel 单独具有耐药性, 并且没有表现出明显的抗肿瘤作用。Adagrasib 和 paclitaxel 联合治疗对肿瘤生长的抑制作用更强。[3]

储存

store at low temperature | Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.