

## AEE788(NVP-AEE788)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
AEE788(NVP-AEE788)	52702ES08	5 mg
	52702ES10	10 mg

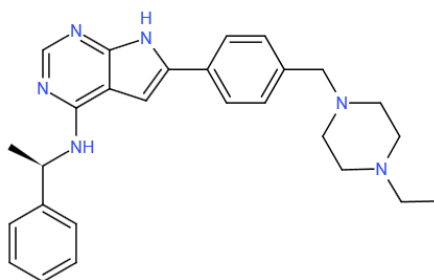
### 产品描述

AEE788 (NVP-AEE788)是一种高效的 EGFR、VEGFR 和 HER2/ErbB2 抑制剂,其对 EGFR 和 ErbB2 的 IC<sub>50</sub> 值分别为 2 nM 和 6 nM, AEE788 也抑制 Flt-1、KDR、c-Src 和 c-Abl, 其作用得 IC<sub>50</sub> 值为 50-80 nM。AEE788 抑制 EGFR 和 Akt 的磷酸化,抑制肿瘤细胞增殖。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	6-{4-[(4-Ethyl-1-piperazinyl)methyl]phenyl}-N-[(1R)-1-phenylethyl]-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-amine ;[6-[4-[(4-Ethylpiperazin-1-yl)methyl]phenyl]-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl]-((R)-1-phenylethyl)amine; AEE-788; AEE 788; NVP AEE 788; AEE788
中文名称 (Chinese Name)	6-[4-[(4-乙基-1-哌嗪)甲基]苯基]-N-[(1R)-1-苯基乙基]-7H-吡咯并[2,3-D]嘧啶-4-胺
靶点 (Target)	EGFR; HER2/ErbB2
CAS 号 (CAS NO.)	497839-62-0
分子式 (Formula)	C <sub>27</sub> H <sub>32</sub> N <sub>6</sub>
分子量 (Molecular Weight)	440.58
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥22.05 mg/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, 有效期 3 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 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) 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）

AEE788 抑制 EGFR 和 VEGF 受体酪氨酸激酶的 IC<sub>50</sub> 值分别是 EGFR(2 nM)、ErbB2(6 nM)、KDR(77 nM)、Flt-1(59 nM)。在细胞中，生长因子诱导的 EGFR 和 ErbB2 磷酸化也被有效抑制(IC<sub>50</sub>: 11 nM 和 220 nM)。AEE788 对 EGFR 和 ErbB2 过表达细胞具有抗增殖活性，并抑制表皮生长因子和 VEGF 刺激的人脐静脉内皮细胞的增殖。<sup>[1]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

AEE788（50 mg/kg，口服给药）处理异种移植瘤的雌性 BALB/c 裸鼠，实验显示 AEE788 能有效抑制肿瘤内生长因子诱导的 EGFR 和 ErbB2 的磷酸化，还能抑制 VEGF 诱导的小鼠移植模型的血管生成。<sup>[1]</sup>在用 AEE788 治疗的小鼠中，在治疗开始后 21 天，与对照组相比，实验组小鼠肿瘤生长被抑制 54%。<sup>[2]</sup>

## 参考文献

- [1]. Traxler P, et al. AEE788: a dual family epidermal growth factor receptor/ErbB2 and vascular endothelial growth factor receptor tyrosine kinase inhibitor with antitumor and antiangiogenic activity. *Cancer Res.* 2004 Jul 15;64(14):4931-4941.
- [2]. Park et al. AEE788, a dual tyrosine kinase receptor inhibitor, induces endothelial cell apoptosis in human cutaneous squamous cell carcinoma xenografts in nude mice. *Clin Cancer Res.* 2005 Mar 1;11(5):1963-1973.