

## Tyrphostin AG 879

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53228ES08	5 mg
Tyrphostin AG 879	53228ES10	10 mg
	53228ES25	25 mg

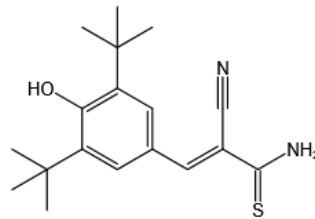
### 产品描述

Tyrphostin AG 879 (AG 879, AG879)是酪氨酸激酶抑制剂, 具有潜在抗癌活性, 能够抑制 TrKA 磷酸化 (IC<sub>50</sub> 为 10 μM), 但对 TrKB 和 TrKC 无影响。此外, Tyrphostin AG 879 也被广泛用作 HER2/ErbB2 的选择性抑制剂 (IC<sub>50</sub> 为 1 μM), 比对 EGFR 和 PDGFR 的选择性高 100-500 倍。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	Tyrphostin AG 879, AG 879, AG879
靶点 (Target)	TrKA phosphorylation, ErbB2
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--Trk Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	148741-30-4
分子式 (Formula)	C <sub>18</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> OS
分子量 (Molecular Weight)	316.46
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°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C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)

在人平滑肌肉瘤(HTB-114, HTB-115, HTB-88)、横纹肌肉瘤(HTB-82, TE-671)、前列腺癌(PC-3)、急性早幼粒细胞白血病(HL-60)和组织细胞淋巴瘤(U-937)细胞系中, AG879 (20  $\mu$ M)抑制细胞增殖, 诱导细胞凋亡。<sup>[1]</sup> AG879 (10 nM)阻断 PAK1 的活化, 并抑制 RAS 诱导的 NIH3T3 细胞癌变。AG879 (<1  $\mu$ M)抑制 v-Ha-RAS 转化的 NIH3T3 细胞中 ERK 的 Tyr 磷酸化, 以及 ERK 与 PAK1 的联合。<sup>[2]</sup> AG879 剂量依赖性抑制 MCF-7 细胞增殖, 并在 0.4 mM 下抑制 DNA 合成和有丝分裂。AG879 (<20  $\mu$ M)抑制 MCF-7 细胞中 ERK-1/2 的活化。AG879 (5  $\mu$ M)减少 RAF-1 和 HER-2 的表达。<sup>[3]</sup>

### (二) 动物实验 (体内实验)

在 HTB-114 或 HL-60 移植瘤小鼠模型中, 皮下注射 AG879 (2 mg), 抑制瘤体生长。<sup>[1]</sup> 携带 v-Ha-RAS 转化的 NIH3T3 细胞的裸鼠中, AG 879 (20 mg/kg)使 50%的小鼠没有 RAS 诱导的肉瘤, 并且显著抑制生长中肉瘤的大小。<sup>[2]</sup>

### 参考文献

- [1]. Rende M et al. Role of nerve growth factor and its receptors in non-nervous cancer growth: efficacy of a tyrosine kinase inhibitor (AG879) and neutralizing antibodies antityrosine kinase receptor A and antinerve growth factor: an in-vitro and in-vivo study. *Anticancer Drugs*. 2006 Sep;17(8):929-41.
- [2]. He H, et al. The Tyr-kinase inhibitor AG879, that blocks the ETK-PAK1 interaction, suppresses the RAS-induced PAK1 activation and malignant transformation. *Cancer Biol Ther*, 2004, 3(1), 96-101.
- [3]. Larsson L I. Novel actions of tyrphostin AG 879: inhibition of RAF-1 and HER-2 expression combined with strong antitumoral effects on breast cancer cells. *Cell Mol Life Sci*. 2004 Oct;61(19-20):2624-31.
- [4]. Levitzki A, et al. Tyrosine kinase inhibition: an approach to drug development. *Science*. 1995 Mar 24;267(5205):1782-8.