

LFM-A13

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53230ES08	5 mg
LFM-A13	53230ES10	10 mg
	53230ES50	50 mg

产品描述

LFM-A13 (LFMA13)是一种特异性布鲁顿氏酪氨酸激酶(BTK)抑制剂,可抑制 BTK、Plx1 和 PLK3 的活性, IC₅₀ 分别为 2.5 μM、10 μM 和 61 μM。BTK 是 B 细胞表面受体(BCR)信号通路的关键激酶,调节 B 细胞的生长、分化,其功能异常被认为和癌症和自体免疫疾病有关。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	LFM-A13, LFMA13
靶点 (Target)	(2Z)-2-氰基-N-(2,5-二溴苯基)-3-羟基-2-丁烯酰胺
通路 (Pathway)	BTK, Plx1, PLK3
CAS 号 (CAS NO.)	Protein Tyrosine Kinase--BTK
分子式 (Formula)	244240-24-2
分子量 (Molecular Weight)	C ₁₁ H ₈ Br ₂ N ₂ O ₂
外观 (Appearance)	360
纯度 (Purity)	粉末
溶解性 (Solubility)	≥98%
结构式 (Structure)	溶于 DMSO

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)

LFM-A13 抑制 BTK 活性, IC₅₀ 为 6.2±0.3 μg/ mL (17.2±0.8 μM), 对 BTK、JAK1、JAK3、IRK、EGFR 和 HCK、K_{is} 为 1.4、110、148、31.6、166 和 214 μM。在 BTK⁺ B 系白血病细胞中, LFM-A13 (200 μM)增强它们对神经酰胺或长春新碱诱导的细胞凋亡的敏感性。^[1] LFM-A13 (100 μM)抑制 R10 细胞中 Epo 诱导的 EpoR、JAK2、BTK、STAT5 和 ERK1/2 的磷酸

化。 LFM-A13 (100 μ M)抑制 COS 细胞中 JAK2, Tec 和 BTK 的自磷酸化, 而不影响 Lyn 激酶自磷酸化。^[2] LFM-A13 有效抑制 Plx1, IC₅₀ 为 10 μ M; 也抑制 BRK、BMX 和 FYN, IC₅₀ 分别为 267、281、240 和 215 μ M。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在 HER2 阳性乳腺癌的 MMTV/Neu 转基因小鼠模型中, 腹腔注射 LFM-A13 (10-50 mg/kg)表现出剂量依赖性的抗肿瘤作用。^[3] 在 DMBA 诱导的乳腺癌小鼠模型中, 腹腔注射 LFM-A13 (50 mg/kg)或与紫杉醇联合, 抑制了小鼠体内 DMBA 诱导的乳腺肿瘤发病率、平均肿瘤数、平均肿瘤重量和大小, 同时上调了乳腺肿瘤中 p21、I κ B、促凋亡蛋白 Bax 和 caspase-3 的水平, 并下调了 PLK1, cyclin D1, CDK4、p53 和抗凋亡蛋白 Bcl-2 的水平。^[4]

参考文献

- [1]. Mahajan S, et al. Rational design and synthesis of a novel anti-leukemic agent targeting Bruton's tyrosine kinase (BTK), LFM-A13 [alpha-cyano-beta-hydroxy-beta-methyl-N-(2, 5-dibromophenyl)propenamide]. *J Biol Chem.* 1999 Apr 2;274(14):9587-99.
- [2]. van den Akker E, et al. The Btk inhibitor LFM-A13 is a potent inhibitor of Jak2 kinase activity. *Biol Chem.* 2004 May;385(5):409-13.
- [3]. Uckun FM, et al. Anti-breast cancer activity of LFM-A13, a potent inhibitor of Polo-like kinase (PLK). *Bioorg Med Chem.* 2007 Jan 15;15(2):800-14.
- [4]. Sahin K, et al. LFM-A13, a potent inhibitor of polo-like kinase, inhibits breast carcinogenesis by suppressing proliferation activity and inducing apoptosis in breast tumors of mice. *Invest New Drugs.* 2018 Jun;36(3):388-395.