

PD153035

产品信息

产品名称	产品编号	规格
PD153035	53441ES08	5 mg
	53441ES25	25 mg

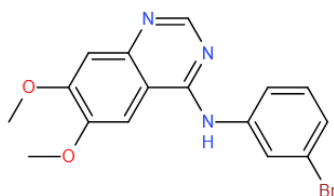
产品描述

PD153035 (SU-5271; AG1517; NSC 669364; ZM 252868) 是一种高效的、特异性的 EGFR 抑制剂 (表皮生长因子受体抑制剂), 竞争性地结合 ATP 位点, 从而抑制 EGFR 的酪氨酸激酶活性, 其 IC_{50} 值为 25 pM, K_i 值为 5.2 pM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	SU-5271; AG1517; NSC 669364; ZM 252868
中文名称 (Chinese Name)	EGFR 抑制剂
靶点 (Target)	EGFR
通路 (Pathway)	JAK/STAT--EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	153436-54-5
分子式 (Formula)	$C_{16}H_{14}BrN_3O_2$
分子量 (Molecular Weight)	360.21
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
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 3 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）

PD153035 (0.5-2800 nM; 2 h)处理一组过表达各种水平的 EGF 受体和 HER2/neu 癌细胞，PD153035 呈剂量依赖性地降低配体诱导的 EGF 受体磷酸化。PD153035 仅在测试的最高浓度(1400-2800 nM)下抑制 HER2/neu 磷酸化。PD153035 还抑制 EGF 受体阳性细胞中的细胞增殖。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

PD153035 (80 mg/kg; 腹腔注射)处理 A431 人表皮样肿瘤异种移植的免疫缺陷裸鼠，结果显示 PD153035 快速抑制肿瘤中 80-90%的 EGF 受体酪氨酸磷酸化。单次腹腔注射剂量为 80 mg/kg 的 PD153035，血浆和肿瘤中的药物水平在 15 分钟内升至 50 和 22 μ M。^[2]

参考文献

- [1] Bos M, et al. PD153035, a tyrosine kinase inhibitor, prevents epidermal growth factor receptor activation and inhibits growth of cancer cells in a receptor number-dependent manner. Clin Cancer Res. 1997 Nov;3(11):2099-106.
- [2] Kunkel MW1, et al. Inhibition of the epidermal growth factor receptor tyrosine kinase by PD153035 in human A431 tumors in athymic nude mice. Invest New Drugs. 1996;13(4):295-302.