

HB181204

17-AAG

产品信息

产品名称	产品编号	规格
17-AAG	51208ES08	5mg
17-AAG	51208ES25	25mg

产品描述

17-AAG 又称为 Tanespimycin、CP 127374, 是一种有效的 Hsp90 抑制剂 ($IC_{50}=5\text{ nM}$)。17-AAG 作用于肿瘤细胞 Hsp90 的亲合力比作用于正常细胞中 Hsp90 亲合力高 100 倍, 另外, 17-AAG 还能抑制 Akt 活化及 HER2、ErbB2 表达。17-AAG 抑制多种癌细胞生长, 如神经胶质瘤细胞等, 在体内外表现出明显的抗肿瘤活性。另外, 17-AAG 与大量抗癌药如 UCN-01, 依托泊苷(etoposide), 顺铂(cisplatin)显示协同作用。

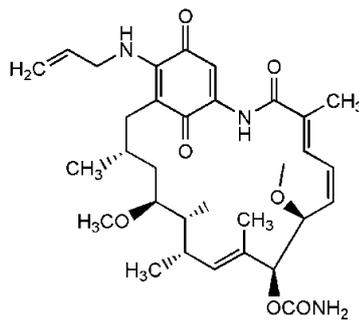
17-AAG 是格尔德霉素(geldanamycin)的半合成类似物, 具有更低的体内毒性和更强的稳定性, 目前已用于乳腺癌等疾病 Phase II 研究阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Tanespimycin, CP 127374, KOS-953, NSC 330507, CNF-101, GLD-36, BMS 722782
化学名 (Chemical Name)	17-demethoxy-17-(2-propenylamino)-geldanamycin
靶点 (Target)	Hsp90
CAS 号 (CAS NO.)	75747-14-7
分子式 (Molecular Formula)	$C_{31}H_{43}N_3O_8$
分子量 (Molecular Weight)	585.69
外观 (Appearance)	紫色固体
纯度 (Purity)	>98 %
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$, 有效期 2 年。易溶于 DMSO。建议分装后 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

1) 为检测肿瘤细胞中 Hsp90 对 17-AAG 的亲合力，10 μ M 17-AAG 分别用于抑制肿瘤细胞和正常细胞 Hsp90 活性，17-AAG 作用于肿瘤细胞 Hsp90 的亲合力比作用于正常细胞中 Hsp90 亲合力高 100 倍。^[2]

2) 为研究 17-AGG 对 Akt 蛋白表达的作用，分别用 1 μ M 17-AAG 处理乳腺癌细胞系（MCF-7 和 MDA-468），50 nM 17-AAG 处理 SKBr-3 和 BT-474 细胞，17-AGG 诱导 Akt 蛋白表达降低，而且磷酸化 Akt 水平下降。^[3]

（二）动物实验（体内研究）

体内研究中，给小鼠腹腔注射（i.p.）17-AGG（75 mg/kg/day），17-AGG 以剂量依赖的方式抑制移植瘤的生长。^[3]

参考文献

- [1] Schulte et al. The benzoquinone ansamycin 17-allylamino-17-demethoxygeldanamycin binds to HSP90 and shares important biologic activities with geldanamycin. *Cancer Chemother Pharmacol.* 42(4):273-279(1998).
- [2] Kamal A, et al. A high-affinity conformation of Hsp90 confers tumour selectivity on Hsp90 inhibitors. *Nature* 425: 407-410 (2003).
- [3] Basso AD, et al. Ansamycin antibiotics inhibit Akt activation and cyclin D expression in breast cancer cells that overexpress HER2. *Oncogene* 21: 1159-1166 (2002).
- [4] Jia W, et al. Synergistic antileukemic interactions between 17-AAG and UCN-01 involve interruption of RAF/MEK- and AKT-related pathways. *Blood.* 102(5):1824-32(2003).
- [5] Qing Y, et al. Synergism between Etoposide and 17-AAG in Leukemia Cells: Critical Roles for Hsp90, FLT3, Topoisomerase II, Chk1, and Rad51. *Clin Cancer Res*, 13:1591-1600(2007)
- [6] Vasilevskava et al. Quantitative effects on c-Jun N-terminal protein kinase signaling determine synergistic interaction of cisplatin and 17-allylamino-17-demethoxygeldanamycin in colon cancer cell lines. *Mol Pharmacol* 65(1):235-43(2004).
- [7] Zsebik B, et al. Hsp90 inhibitor 17-AAG reduces ErbB2 levels and inhibits proliferation of the trastuzumab resistant breast tumor cell line JIMT-1. *Immunology Letters* 104(1-2): 146-155(2006).