

## PP121

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
PP121	53428ES10	10 mg

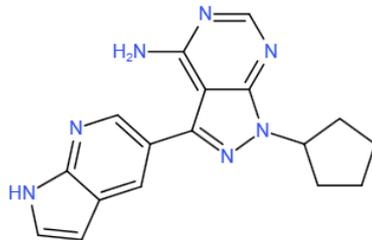
### 产品描述

PP121 (PP-121)是 mTOR、PDGFR、Hck、VEGFR2、Src、DNA-PK、Abl 的多靶点抑制剂，其 IC<sub>50</sub> 值分别为 10 nM、2 nM、8 nM、12 nM、14 nM、60 nM 和 18 nM。PP121 可显著抑制异种移植肿瘤中 Akt-mTOR 和 NFκB 的激活。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	PP-121; PP 121
中文名称 (Chinese Name)	多靶点抑制剂
靶点 (Target)	mTOR; PDGFR; Hck; VEGFR2; Src; DNA-PK; Abl
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--Akt
CAS 号 (CAS NO.)	1092788-83-4
分子式 (Formula)	C <sub>17</sub> H <sub>17</sub> N <sub>7</sub>
分子量 (Molecular Weight)	319.36
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 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)

在细胞中, PP121 可逆转 v-Src 介导的细胞转化和还原肌动蛋白应力纤维染色。PP121 也可在甲状腺瘤中有效抑制突变 Ret 激酶, IC<sub>50</sub> 值小于 1 nM。此外, PP121 还可通过靶向 Bcr-Abl 介导的细胞存活和 PI3-K/mTOR 介导的细胞增殖, 逃避抗药性。<sup>[1]</sup>

### (二) 动物实验 (体内实验)

PP121 (口服) 明显抑制 Eca-109 异种移植瘤生长, 小鼠体重不受 PP121 或载体处理的显著影响。PP121 口服给药可显著抑制异种移植肿瘤中 Akt-mTOR 和 NFκB 的激活, p-Akt Ser 473 和 p-IKKα/b 均受到 PP121 给药的抑制。<sup>[2]</sup>

### 参考文献

- [1] Apsel B, et al. Targeted polypharmacology: discovery of dual inhibitors of tyrosine and phosphoinositide kinases. *Nature chemical biology*, 2008, 4(11): 691-699.
- [2] Peng Y, et al. The anti-esophageal cancer cell activity by a novel tyrosine/phosphoinositide kinase inhibitor PP121. *Biochem Biophys Res Commun*. 2015 Sep 11;465(1):137-44.