

产品名称：曲匹地尔
产品别名：Trapidil

生物活性:						
Description		Trapidil 是 PDGF 的拮抗剂，可以抑制生成 PDGF 的神经胶质瘤细胞的增殖。				
IC ₅₀ & Target		PDGF [1]				
In Vitro		Trapidil 会破坏 PDGF 和 PDGF 受体的自分泌环，具有显著的抗增殖活性[1]。100-400 μg/ml trapidil 通过不同的生长因子（FCS, PDGF-BB, bFGF, EGF）显著地减少细胞增殖，其中，对 PDGF-BB 的抑制作用最大。Trapidil 的作用具有浓度依赖性并十分特异。Trapidil 是一种抗血小板聚集药物，对多种诱聚剂具有活性，如胶原、ADP、花生四烯酸、PAF 和钙离子载体。它通过阻滞 thromboxane A2 的生物合成并于受体水平对之进行拮抗发挥作用。同时刺激环前列腺素的生物合成和释放[2]。Trapidil 在骨髓细胞和造骨细胞共同培养的培养基中，强烈地抑制破骨细胞形成，而不影响 NF-κB 配体的受体激活剂（RANKL）或是造骨细胞中的护骨素的表达。除此之外，trapidil 还能抑制 RANKL 诱导的破骨细胞前体向破骨细胞的分化形成。Trapidil 减少 RANKL 诱导的活化 T 细胞核因子 NFATc1 的表达，而不影响 c-Fos 的表达。据报道，Trapidil 还抑制磷酸二酯酶、thromboxane A2、CD40 信号通路和活化的 PKA[3]。				
In Vivo		Trapidil 是抗血小板药，对 PDGF 具有特异性拮抗作用，在大鼠和兔子气囊血管成形术后，Trapidil 具有抗增殖效果[1]。在动物模型中，Trapidil 对破骨细胞形成和 interleukin-1 诱导的骨吸收具有有效的抑制作用。在腹腔注射 trapidil 后，没有异常的症状，如体重变化、腹泻、高烧、震颤等[3]。				
Solvent&Solubility		In Vitro: DMSO: 41 mg/mL (199.75 mM) Water: 41 mg/mL (199.75 mM) Ethanol: 41 mg/mL (199.75 mM)				
		Preparing Stock Solutions	<div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
			1 mM	4.8719 mL	24.3593 mL	48.7187 mL
			5 mM	0.9744 mL	4.8719 mL	9.7437 mL
			10 mM	0.4872 mL	2.4359 mL	4.8719 mL
			50 mM	0.0974 mL	0.4872 mL	0.9744 mL
*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃，6 months；-20℃，1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。						
References		[1] Maresta A, et al. Circulation. 1994, 90(6):2710-5. [2] Gesualdo L, et al. Kidney Int. 1994, 46(4):1002-9. [3] Kim SD, et al. Biochem Pharmacol. 2013, 86(6):782-90.				
实验参考:						
Cell Assay		细胞实验: [2] Cell lines: 人类系膜细胞 Concentrations: 100 μg/ml Incubation Time: 96 h Method: 通过台盼蓝染料拒染试验和 LDH 试验检测细胞活力。将细胞接种于无血清培养基中，并处理以不同的				

	分裂素和药物。然后离心测定 LDH 浓度。收集超声处理后的细胞上清液作为阳性对照。
Animal Administration	动物实验: [3] Animal Models: ICR 小鼠 Formulation: PBS Dosages: 5 或 20 mg/kg Administration: 腹腔注射
References	[1] Maresta A, et al. Circulation. 1994, 90(6):2710-5. [2] Gesualdo L, et al. Kidney Int. 1994, 46(4):1002-9. [3] Kim SD, et al. Biochem Pharmacol. 2013, 86(6):782-90.



源叶生物