上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

产品名称：Tranilast
CAS 号：53902-12-8
产品货号：S80787

生物活性：

Description

Tranilast (MK-341) 是一种抗变态反应剂。抑制前列腺素 D2 产生 (PGD2，IC50=0.1 mM)。具有抗炎和免疫调节作用。Tranilast sodium 拮抗血管紧张素 II (angiotensin II) 并抑制其在血管平滑肌细胞中的生物学作用.

IC50 & Target

Angiotensin II	DP2 0.1 mM (IC_{50})

Cellular Effect

Cell Line	Type	Value	Description
HEK293	IC_{50}	126 μM	Antagonist activity at human TRPA1 expressed in HEK293 cells assessed as inhibition of CA-induced increase in calcium influx incubated for 10 mins prior to CA addition by Fluo-4-AM dye based fluorescence assayy
RBL-2H3	IC_{50}	0.49 mM	Inhibition of beta-hexosaminidase in anti-DNP IgE sensitized rat RBL2H3 cells after 10 mins
RBL-2H3	IC_{50}	0.49 mM	Inhibition of rat RBL2H3 cell degranulation assessed as inhibition of beta-hexosamidase release after 10 mins by microplate reader assay

In Vitro

Tranilast 表现出显著的免疫调节活性，可抑制内毒素诱导的前列腺素 E2 (PGE2; IC50=~1-20 μM)、血栓素 B2 (IC50=~10-50 μM)，(TGF-β1；IC50=~100-200 μM)，和 IL-8 (IC50=~100 μM) 形成。Tranilast 抑制 A23187 诱导的单核细胞白三烯 C4 或 PGE2 形成，IC50 分别为 10-40 μM 和 2 -20 μM[3]。

Tranilast (10 -200 μM) 在 MCF-7 和 MDA-MB-231 细胞系中表现出剂量依赖性的抗增殖作用。Tranilast (10 -200 μM) 还增强他莫昔芬 (1 -20 μM) 在体外对人乳腺癌细胞的抗肿瘤作用[4]。

Tranilast (12.5, 25, 50, 100 μg/mL; 72 hours) 抑制 HDMECs 的增殖[5].

Cell Proliferation Assay[4]

Cell Line:	MCF-7 and MDA-MB-231 cells
Concentration:	10, 20, 50, 100, and 200 μM
Incubation Time:	48 hours
Result:	Anti-proliferative effect in a dose-dependent manner in both cell lines.

Cell Viability Assay[5]

Cell Line:	Human dermal microvascular endothelial cells (HDMECs)
Concentration:	12.5, 25, 50, 100 μg/mL
Incubation Time:	72 hours
Result:	IC50 value was 44.3 μg/mL (136 μM).

In Vivo

Tranilast (300 mg/kg; administered orally twice a day for 3 days) 剂量依赖性地抑制小鼠的血管生成[5]。

Animal Model:	Nine-week-old male C57BL/6 mice[5]
Dosage:	300 mg/kg
Administration:	Administered orally twice a day for 3 days

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

	Result:	Suppressed the VEGF-induced angiogenesis in matrigel; 58% of significant suppression was observed at a dose of 300 mg/kg. The ED_{50} value and 95% confidence limits were 165 mg/kg and 162±169 mg/kg, respectively.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：50 mg/mL (152.75 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	3.0550 mL	15.2751 mL	30.5502 mL
	5 mM	0.6110 mL	3.0550 mL	6.1100 mL
	10 mM	0.3055 mL	1.5275 mL	3.0550 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°C, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时，请在 1 年内使用， -20°C 储存时，请在 6 个月内使用。

动物实验：

请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。

以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用；

以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

方案 一

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.64 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。

生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH_2O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。

方案 二

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (7.64 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。

2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

方案 三

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.64 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

	酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比； 如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶。 方案 一 请依序添加每种溶剂： 30% SBE-β-CD in Saline Solubility: 5 mg/mL (15.28 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂： 1.5% CMC-Na/saline water Solubility: 4 mg/mL (12.22 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. K Ikai , et al. Inhibitory Effect of Tranilast on Prostaglandin D Synthetase. Biochem Pharmacol. 1989 Aug 15;38(16):2673-6. [2]. K Miyazawa , et al. Tranilast Antagonizes Angiotensin II and Inhibits Its Biological Effects in Vascular Smooth Muscle Cells. Atherosclerosis. 1996 Apr 5;121(2):167-73. [3]. E A Capper, et al. Modulation of Human Monocyte Activities by Tranilast, SB 252218, a Compound Demonstrating Efficacy in Restenosis. J Pharmacol Exp Ther. 2000 Dec;295(3):1061-9. [4]. Sara Darakhshan, et al. Tranilast Enhances the Anti-Tumor Effects of Tamoxifen on Human Breast Cancer Cells in Vitro. J Biomed Sci. 2013 Oct 21;20(1):76. [5]. M Isaji , et al. Tranilast Inhibits the Proliferation, Chemotaxis and Tube Formation of Human Microvascular Endothelial Cells in Vitro and Angiogenesis in Vivo. Br J Pharmacol. 1997 Nov;122(6):1061-6.

完整储备液配制表：

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°C, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时，请在 1 年内使用， -20°C 储存时，请在 6 个月内使用。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	3.0550 mL	15.2751 mL	30.5502 mL	76.3755 mL
	5 mM	0.6110 mL	3.0550 mL	6.1100 mL	15.2751 mL
	10 mM	0.3055 mL	1.5275 mL	3.0550 mL	7.6376 mL
	15 mM	0.2037 mL	1.0183 mL	2.0367 mL	5.0917 mL
	20 mM	0.1528 mL	0.7638 mL	1.5275 mL	3.8188 mL
	25 mM	0.1222 mL	0.6110 mL	1.2220 mL	3.0550 mL
	30 mM	0.1018 mL	0.5092 mL	1.0183 mL	2.5459 mL
	40 mM	0.0764 mL	0.3819 mL	0.7638 mL	1.9094 mL

上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话：021-61312973　　传真：021-55068248
网址：www.shyuanye.com
邮箱：shyysw@sina.com

	50 mM	0.0611 mL	0.3055 mL	0.6110 mL	1.5275 mL
	60 mM	0.0509 mL	0.2546 mL	0.5092 mL	1.2729 mL
	80 mM	0.0382 mL	0.1909 mL	0.3819 mL	0.9547 mL
	100 mM	0.0306 mL	0.1528 mL	0.3055 mL	0.7638 mL