



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **TAE684 (NVP-TAE684)**

CAS 号: **761439-42-3**

产品货号: **S86440**

生物活性:				
Description	NVP-TAE 684 (TAE 684) 是一种高效的, 选择性的 ALK 抑制剂, 阻止 ALCL 衍生的 ALK 依赖性细胞株的生长, IC50 值为 2-10 nM。			
IC50 & Target	IC50: 2-10 nM (ALK-dependent cell lines)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	BaF3	IC ₅₀	0.001μM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells expressing Tel-ALK after 48 hrs by CellTiter-Glo assay
	BaF3	IC ₅₀	0.02μM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells expressing EML4-ALK after 48 hrs by MTS assay
	BaF3	IC ₅₀	0.06μM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells expressing ALK F1174L mutant coexpressing EML4 after 48 hrs by MTS assay
	BaF3	IC ₅₀	0.08μM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells expressing ALK L1196M mutant coexpressing EML4 after 48 hrs by MTS assay
	BaF3	GI ₅₀	1.1μM	Antiproliferative activity against mouse BAF3 cells after 72 hrs by CellTiter-Glo assay
	BaF3	IC ₅₀	1336 nM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells after 2 to 3 days by luciferase reporter gene assay
	BaF3	IC ₅₀	229.3 nM	Cytotoxicity against mouse BaF3 cells expressing human EGFR C797S/del19 mutant assessed as inhibition of in cell viability measured after 72 hrs by CellTiter-Glo assay
	BaF3	IC ₅₀	3 nM	Cytotoxicity against mouse BAF3 cells expressing NPM-ALK after 48 hrs by CellTiter-Glo assay
	BaF3	IC ₅₀	3.7 nM	Inhibition of NPM-fused ALK (unknown origin) expressed in mouse BAF3 cells after 2 to 3 days by luciferase reporter gene assay
	BaF3	IC ₅₀	340.7 nM	Cytotoxicity against mouse BaF3 cells expressing human EGFR C797S/T790M/del19 mutant assessed as inhibition of in cell viability measured after 72 hrs by CellTiter-Glo assay
	BaF3	IC ₅₀	43.7 nM	Inhibition of TEL-fused insulin receptor (unknown origin) expressed in mouse BAF3 cells after 2 to 3 days by luciferase reporter gene assay
	HEK293	IC ₅₀	21.9 nM	Inhibition of LRRK2 G2019S and A2016T mutant expressed in HEK293 cells using nictide and ATP as substrate
	HEK293	IC ₅₀	6.1 nM	Inhibition of LRRK2 G2019S mutant expressed in HEK293 cells using nictide and ATP as substrate



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: shyyw@sina.com

	HEK293	IC ₅₀	7.8 nM	Inhibition of wild-type LRRK2 expressed in HEK293 cells using nictide and [gamma32]ATP as substrate
	HEK293	IC ₅₀	93.3 nM	Inhibition of LRRK2 A2016T mutant expressed in HEK293 cells using nictide and ATP as substrate
	KARPAS-299	IC ₅₀	< 10 nM	Decrease in ALK phosphorylation in human Karpas299 cells after 4 hrs
	KARPAS-299	IC ₅₀	13 nM	Antiproliferative activity against ALK-dependent human KARPAS299 cells after 72 hrs
	KARPAS-299	IC ₅₀	14 nM	Antiproliferative activity against human ALK-positive KARPAS299 cells assessed as reduction in cell viability measured after 72 hrs by CellTiter 96 aqueous one solution cell proliferation assay
	KARPAS-299	IC ₅₀	2 nM	Antiproliferative activity against human Karpas299 cells assessed as luciferase expression after 72 hrs
	KARPAS-299	IC ₅₀	2.4 nM	Cytotoxicity against human KARPAS299 cells after 2 to 3 days by luciferase reporter gene assay
	KARPAS-299	IC ₅₀	3 nM	Induction of apoptosis in human Karpas299 cells by annexin V assay
	NCI-H1975	GI ₅₀	0.72μM	Growth inhibition of human NCI-H1975 cells after 72 hrs by CellTiter-Glo assay
	SU-DHL-1	IC ₅₀	2 nM	Antiproliferative activity against human SUDHL1 cells assessed as luciferase expression after 72 hrs
Antiproliferative activity against human SUDHL1 cells assessed as luciferase expression after 72 hrs				
In Vitro	TAE684 抑制 Ba/F3 NPM-ALK 细胞的增殖, IC50 为 3 nM, 浓度高达 1 μM 时不影响亲代 Ba/F3 细胞的存活。TAE684 在 Ba/F3 NPM-ALK 和 Karpas-299 细胞中以剂量依赖性方式抑制 STAT3 和 STAT5 磷酸化。TAE684 在表达 NPM-ALK 的 Ba/F3 细胞和 ALCL 细胞系中诱导细胞凋亡和 G1 期阻滞[1]。			
	NVP-TAE684 显著降低敏感 H3122 和 H3122 CR 细胞的细胞存活率,但对其他非 ALK 依赖性癌细胞系的活力几乎没有影响。NVP-TAE684 处理 H3122 CR 细胞抑制 ALK、AKT 和 ERK 的磷酸化并诱导显著的细胞凋亡。			
	TAE684 有效抑制表达 EML4-ALK L1196M 突变体的 Ba/F3 细胞的存活[2]。 mALKR1279Q 突变体表达诱导的神经突生长在 30 nM NVP-TAE684 下被完全抑制,这与激活的 wt mALK 所见的反应相当[3]。			
In Vivo	NVP-TAE684 在两个独立的 ALK 阳性 ALCL 模型中抑制淋巴瘤形成,并诱导已建立的 Karpas-299 淋巴瘤消退。NVP-TAE684 在体内显示出可观的生物利用度和半衰期。			
	NVP-TAE684 (1、3 和 10 mg/kg. po) 显著延迟淋巴瘤的发展,并显示发光信号减少 100 到 1,000 倍。NVP-TAE684 (10 mg/kg) 处理组看起来很健康,没有表现出任何化合物或疾病相关毒性的迹象[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 7.69 mg/mL (12.52 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



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

	Preparing	1 mM	1.6281 mL	8.1407 mL	16.2813 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3256 mL	1.6281 mL	3.2563 mL
		10 mM	0.1628 mL	0.8141 mL	1.6281 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 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: ≥ 0.77 mg/mL (1.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.77 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 7.7 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 ddH₂O 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: ≥ 0.77 mg/mL (1.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.77 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 7.7 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。					
参考文献	[1]. Galkin AV, et al. Identification of NVP-TAE684, a potent, selective, and efficacious inhibitor of NPM-ALK. Proc Natl Acad Sci U S A. 2007 Jan 2;104(1):270-5. [2]. Katayama R, et al. Therapeutic strategies to overcome PF-02341066 resistance in non-small cell lung cancers harboring the fusion oncogene EML4-ALK. Proc Natl Acad Sci U S A. 2011 May 3;108(18):7535-40. [3]. Schonherr C, Activating ALK mutations found in neuroblastoma are inhibited by PF-02341066 and NVP-TAE684. Biochem J. 2011 Dec 15;440(3):405-13.				
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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg



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

DMSO	1 mM	1.6281 mL	8.1407 mL	16.2813 mL	40.7034 mL
	5 mM	0.3256 mL	1.6281 mL	3.2563 mL	8.1407 mL
	10 mM	0.1628 mL	0.8141 mL	1.6281 mL	4.0703 mL



源叶