



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: **AG 494**
CAS 号: **133550-35-3**
产品货号: **S88020**

生物活性:

Description	AG-494 (Tyrphostin AG 494) 是一种高效、选择性的 EGFR 酪氨酸激酶抑制剂 (IC ₅₀ =0.7 μM)。AG-494 抑制 EGFR、ErbB2、HER1-2 和 PDGF-R 的自磷酸化, IC ₅₀ 为 1.1, 39, 45 和 6 μM。AG-494 阻断 Cdk2 的激活并抑制 EGF 依赖的 DNA 合成。			
IC ₅₀ & Target[1][2]	EGFR 0.7 μM (IC ₅₀)			
In Vitro	在 DHER-14 细胞中, AG 494 抑制 Cdk2 激活和 EGF 依赖性 DNA 合成[2]。 AG-494 显著阻止二氧化硅刺激细胞中的 NF-κB 激活, 并且还减少在 H ₂ O ₂ 处理的细胞中激活 NF-κB[4]。 AG-494 (3-9 μM; 5-7 天) 以剂量依赖的方式抑制 BMP9 诱导的 ALP 活性[5]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (356.79 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)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
			1 mg	5 mg
			10 mg	
		1 mM	3.5679 mL	17.8393 mL
		5 mM	0.7136 mL	3.5679 mL
		10 mM	0.3568 mL	1.7839 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, 2 years; -20°C, 1 year (protect from light)。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 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: ≥ 2.5 mg/mL (8.92 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 ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。			
参考文献	[1]. Gazit A, et al. Tyrphostins. 2. Heterocyclic and alpha-substituted benzyldenemalononitrile tyrphostins as potent inhibitors of EGF receptor and ErbB2/neu tyrosine kinases. J Med Chem. 1991;34(6):1896-1907.			



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

	[2]. Oshero N, et al. Tyrphostin AG 494 blocks Cdk2 activation. FEBS Lett. 1997;410(2-3):187-190. [3]. Oshero N, et al. Selective inhibition of the epidermal growth factor and HER2/neu receptors by tyrphostins. J Biol Chem. 1993 May 25;268(15):11134-42. [4]. Liu X, Qin J, et al. Cross-talk between EGF and BMP9 signalling pathways regulates the osteogenic differentiation of mesenchymal stem cells. J Cell Mol Med. 2013;17(9):1160-1172. [5]. Jihee Lee Kang, et al. SILICA-INDUCED NUCLEAR FACTOR-κB ACTIVATION: INVOLVEMENT OF REACTIVE OXYGEN SPECIES AND PROTEIN TYROSINE KINASE ACTIVATION. Journal of Toxicology and Environmental Health, Part A.
--	---

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 , 2 years; -20°C , 1 year (protect from light)。 -80°C 储存时,请在 2 年内使用, -20°C 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
DMSO	1 mM	3.5679 mL	17.8393 mL	35.6786 mL	89.1965 mL
	5 mM	0.7136 mL	3.5679 mL	7.1357 mL	17.8393 mL
	10 mM	0.3568 mL	1.7839 mL	3.5679 mL	8.9197 mL
	15 mM	0.2379 mL	1.1893 mL	2.3786 mL	5.9464 mL
	20 mM	0.1784 mL	0.8920 mL	1.7839 mL	4.4598 mL
	25 mM	0.1427 mL	0.7136 mL	1.4271 mL	3.5679 mL
	30 mM	0.1189 mL	0.5946 mL	1.1893 mL	2.9732 mL
	40 mM	0.0892 mL	0.4460 mL	0.8920 mL	2.2299 mL
	50 mM	0.0714 mL	0.3568 mL	0.7136 mL	1.7839 mL
	60 mM	0.0595 mL	0.2973 mL	0.5946 mL	1.4866 mL
	80 mM	0.0446 mL	0.2230 mL	0.4460 mL	1.1150 mL
	100 mM	0.0357 mL	0.1784 mL	0.3568 mL	0.8920 mL