



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: Tyrphostin AG 1296

CAS 号: 146535-11-7

产品货号: S88036

生物活性:

生物活性:				
Description	Tyrphostin AG1296 是一种有效的、选择性血小板衍生生长因子受体 (PDGFR) 抑制剂, IC50 值为 0.8 μM。Tyrphostin AG1296 抑制人 PDGF α 和 β 受体以及相关干细胞因子受体 (c-Kit) 的信号传导。Tyrphostin AG1296 也是有效的 FLT3 抑制剂, IC50 值在微摩尔范围内。			
IC50 & Target[2]	PDGFRα		PDGFRβ	
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Caco-2	IC50	0.2 μM	Determination of IC50 values for inhibition of SARS-CoV-2 induced cytotoxicity of Caco-2 cells after 48 hours by high content imaging
	Caco-2	CC50	1.36 μM	Toxicity against Caco-2 cells determined at 48 hours by intracellular ATP concentration using the CellTiter-Glo Luminescent Cell Viability Assay
In Vitro	Tyrphostin AG1296 (0.625 -20 μM; 72 h) 抑制 PLX4032 耐药黑色素瘤细胞的活力[4]。			
	Tyrphostin AG1296 (2.5 -20 μM; 48 h) 诱导 A375R 细胞凋亡[4]。			
	Tyrphostin AG1296 (5 和 20 μM; 2 小时) 抑制 A375R 细胞中的 PDGFR 磷酸化[4]。			
	Tyrphostin AG1296 (0.0625-1 μM; 8 h) 抑制 A375R 细胞的迁移[4]。			
	Cell Viability Assay[4]			
	Cell Line:		PLX4032-resistant cell lines (A375R and SK-MEL-5R)	
	Concentration:		0.625, 1.25, 5, 20 μM	
	Incubation Time:		72 h	
	Result:		Reduced the viability of both PLX4032-sensitive and PLX4032-resistant cell lines.	
	Apoptosis Analysis[4]			
	Cell Line:		A375R cells	
	Concentration:		2.5, 5, 10, 20 μM	
	Incubation Time:		48 h	
	Result:		Induced dramatic apoptosis in A375R cells.	
	Western Blot Analysis[4]			
Cell Line:		A375R cells		
Concentration:		5, 20 μM		
Incubation Time:		2 h		
Result:		Inhibited phosphorylation of both PDGFR-伪 and PDGFR-尾.		
In Vivo	Tyrphostin AG1296 (40 和 80 mg/kg; 每天腹腔内注射, 持续两周) 在体内抑制 A375R 肿瘤生长[4]。			
	Tyrphostin AG1296 (2 mg/kg; 每隔一天腹腔内注射, 持续 3 周) 通过抑制炎症反应、降低基质金属蛋白酶的表达、促进巨噬细胞从促炎表型向抗炎表型转变, 从而抑制动脉粥样硬化斑块进展, 增强斑块稳定性[5]。			
	Animal Model:		Nud/nud mice are injected with A375R cells[4]	
	Dosage:		40, 80 mg/kg	



	Administration: I.p. daily for two weeks Result: Led to an intermediate level of tumor growth suppression at dose of 40 mg/kg, and significant inhibition of A375R tumor growth at dose of 80 mg/kg. Well tolerated by healthy mice without significant signs of overt toxicity or weight loss.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (125.16 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	3.7553 mL	18.7765 mL	37.5530 mL
		5 mM	0.7511 mL	3.7553 mL	7.5106 mL
		10 mM	0.3755 mL	1.8777 mL	3.7553 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, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (9.39 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.39 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。					
参考文献	[1]. Gazit A, et al. Tyrphostins. 5. Potent inhibitors of platelet-derived growth factor receptor tyrosine kinase: structure-activity relationships in quinoxalines, quinolines, and indole tyrphostins. Comparative Study J Med Chem. 1996 May 24; 39(11): 2170-7.				
	[2]. Kovalenko M, et al. Selective platelet-derived growth factor receptor kinase blockers reverse				



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

	sis-transformation. Cancer Res. 1994 Dec 1; 54(23): 6106-14. [3]. Tse KF, et, al. Inhibition of the transforming activity of FLT3 internal tandem duplication mutants from AML patients by a tyrosine kinase inhibitor. Leukemia. 2002 Oct; 16(10): 2027-36. [4]. Li Y, et, al. Tyrphostin AG1296, a platelet-derived growth factor receptor inhibitor, induces apoptosis, and reduces viability and migration of PLX4032-resistant melanoma cells. Onco Targets Ther. 2015 May 14; 8: 1043-51. [5]. Dong M, et, al. AG1296 enhances plaque stability via inhibiting inflammatory responses and decreasing MMP-2 and MMP-9 expression in ApoE^{-/-} mice. Biochem Biophys Res Commun. 2017 Aug 5;489(4):426-431.
--	--

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, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时,请在 6 个月内使用, -20° C 储存时,请在 1 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	3.7553 mL	18.7765 mL	37.5530 mL	93.8826 mL
	5 mM	0.7511 mL	3.7553 mL	7.5106 mL	18.7765 mL
	10 mM	0.3755 mL	1.8777 mL	3.7553 mL	9.3883 mL
	15 mM	0.2504 mL	1.2518 mL	2.5035 mL	6.2588 mL
	20 mM	0.1878 mL	0.9388 mL	1.8777 mL	4.6941 mL
	25 mM	0.1502 mL	0.7511 mL	1.5021 mL	3.7553 mL
	30 mM	0.1252 mL	0.6259 mL	1.2518 mL	3.1294 mL
	40 mM	0.0939 mL	0.4694 mL	0.9388 mL	2.3471 mL
	50 mM	0.0751 mL	0.3755 mL	0.7511 mL	1.8777 mL
	60 mM	0.0626 mL	0.3129 mL	0.6259 mL	1.5647 mL
	80 mM	0.0469 mL	0.2347 mL	0.4694 mL	1.1735 mL
	100 mM	0.0376 mL	0.1878 mL	0.3755 mL	0.9388 mL