



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: PD0166285

CAS 号: 185039-89-8

产品货号: S88063

生物活性:

Description	PD0166285 是 P-gp 的一个底物, 是 WEE1 抑制剂, 也可微弱抑制 Myt1, IC50 值分别为 24 和 72 nM。PD0166285 对 Chk1 的 IC50 值为 3.433 μ M。			
IC50 & Target	IC50: 24 nM (WEE1), 72 nM (Myt1), 3.433 μ M (Chk1)[1].			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	C6	IC ₅₀	0.005 μ M	Inhibition of PDGF-stimulated Platelet-derived growth factor receptor autophosphorylation in C6 rat glioma cells after 2 hr
	C6	IC ₅₀	0.12 μ M	C6 glioma 3-day proliferation followed by soft agar growth with continuous treatment
	C6	IC ₅₀	1.8 μ M	C6 glioma 3-day proliferation followed by soft agar growth without treatment
	HEK293	IC ₅₀	7.2 nM	Binding affinity to human full-length His-tagged Myt1 kinase expressed in HEK293 cells by TR-FRET based binding assay
	HEK-293T	IC ₅₀	0.29 μ M	Antiproliferative activity against HEK293T cells measured after 72 hrs by CellTiter-Blue assay
	MDA-MB-231	IC ₅₀	0.16 μ M	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells measured after 72 hrs by CellTiter-Blue assay
	MM1.S	IC ₅₀	0.52 μ M	Antiproliferative activity against human MM1S cells measured after 72 hrs by CellTiter-Blue assay
	NIH3T3	IC ₅₀	0.35 μ M	Inhibition of NIH3T3 proliferation by sulforhodamine B assay
In Vitro	PD0166285 (0.5 μ M) 可显著抑制 7 种癌细胞系中的 7 种中 Tyr-15 和 Thr-14 位点的放射诱导 Cdc2 磷酸化[1]。			
	PD0166285 可增强 p53 突变体 HT29 细胞和 E6 转染的 p53 基因敲除卵巢癌细胞系 PA-1 中放射诱导的细胞杀伤, 但在 p53 野生型 PA-1 细胞中作用较小。PD0166285 可消除放射诱导的 G2 期停滞, 并显著增加有丝分裂细胞数量[1]。			
	PD0166285 可作为放射增敏剂, 使细胞对放射诱导的细胞死亡敏感, 增敏倍数为 1.23[1]。			
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	Human and mouse cancer cell lines (HCT116, HT29, DLD-1, HCT8, H460, HeLa, C 26).		
	Concentration:	0.5 μ M.		
In Vivo	Incubation Time:	4 h.		
	Result:	Inhibited Cdc2Y15 and CdcT14 phosphorylation.		
	Animal Model:	Wild-type, Abcg2 ^{-/-} , Abcb1a/b ^{-/-} and Abcb1a/b;Abcg2 ^{-/-} FVB mice[2].		
	Dosage:	5 mg/kg.		
	Administration:	IV.		
	Result:	C _{max} is about 400 ng/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: shyyysw@sina.com

	P-gp, but not BCRP, limited the brain penetration of PD0166285.				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (97.57 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	1.9515 mL	9.7574 mL	19.5149 mL
		5 mM	0.3903 mL	1.9515 mL	3.9030 mL
		10 mM	0.1951 mL	0.9757 mL	1.9515 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。 -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 (4.88 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 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% Corn Oil Solubility: 2.17 mg/mL (4.23 mM); 澄清溶液; 加热助溶 此方案可获得 2.17 mg/mL 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 21.7 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]. Wang Y, et al. Radiosensitization of p53 mutant cells by PD0166285, a novel G(2) checkpoint abrogator. Cancer Res. 2001 Nov 15;61(22):8211-7. [2]. Mark C de Gooijer, et al. ATP-binding cassette transporters limit the brain penetration of Wee1 inhibitors. Invest New Drugs. 2018 Jun;36(3):380-387.				
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。 -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年					



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

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	1.9515 mL	9.7574 mL	19.5149 mL	48.7872 mL
	5 mM	0.3903 mL	1.9515 mL	3.9030 mL	9.7574 mL
	10 mM	0.1951 mL	0.9757 mL	1.9515 mL	4.8787 mL
	15 mM	0.1301 mL	0.6505 mL	1.3010 mL	3.2525 mL
	20 mM	0.0976 mL	0.4879 mL	0.9757 mL	2.4394 mL
	25 mM	0.0781 mL	0.3903 mL	0.7806 mL	1.9515 mL
	30 mM	0.0650 mL	0.3252 mL	0.6505 mL	1.6262 mL
	40 mM	0.0488 mL	0.2439 mL	0.4879 mL	1.2197 mL
	50 mM	0.0390 mL	0.1951 mL	0.3903 mL	0.9757 mL
	60 mM	0.0325 mL	0.1626 mL	0.3252 mL	0.8131 mL
	80 mM	0.0244 mL	0.1220 mL	0.2439 mL	0.6098 mL

源叶