



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: PD-166866 (PD166866)

CAS 号: 192705-79-6

产品货号: S88065

生物活性:

Description	PD166866 是选择性的 FGFR1 酪氨酸激酶抑制剂, IC50 值为 52.4 nM。				
IC50 & Target[1]	FGFR1				
	52.4 nM (IC ₅₀)				
In Vitro	PD 166866 抑制人全长 FGFR-1 酪氨酸激酶, IC50 值为 52.4 nM, 是 FGFR-1 的 ATP 竞争性抑制剂。PD 166866 是表达内源性 FGFR-1 的 NIH 3T3 细胞和过表达人 FGFR-1 酪氨酸激酶的 L6 细胞中 FGFR 自磷酸化的有效抑制剂。PD 166866 还抑制 L6 细胞中 bFGF 诱导的 44-和 42-kDa (ERK 1/2) 丝裂原活化蛋白激酶亚型的酪氨酸磷酸化。PD 166866 每天暴露于浓度为 1 至 100 nM 的 L6 细胞, 导致连续 8 天浓度相关地抑制 bFGF 刺激的细胞生长, IC50 值为 24 nM[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 3.33 mg/mL (8.40 mM; 超声助溶 (<60° C); 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	2.5224 mL	12.6122 mL	25.2245 mL
		5 mM	0.5045 mL	2.5224 mL	5.0449 mL
		10 mM	---	---	---
*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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 1 mg/mL (2.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 10.0 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: ≥ 1 mg/mL (2.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 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 10.0 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: 0.5% CMC-Na/saline water Solubility: 3.33 mg/mL (8.40 mM); 悬浊液; Need ultrasonic and warming and heat to 40°C。
参考文献	[1]. Panek RL, et al. In vitro biological characterization and antiangiogenic effects of PD 166866, a selective inhibitor of the FGF-1 receptor tyrosine kinase. J Pharmacol Exp Ther. 1998 Jul;286(1):569-77. [2]. Thompson AM, Connolly CJ, Hamby JM, et al. 3-(3,5-Dimethoxyphenyl)-1,6-naphthyridine-2,7-diamines and related 2-urea derivatives are potent and selective inhibitors of the FGF receptor-1 tyrosine kinase. J Med Chem. 2000;43(22):4200-4211.

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 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	浓度				
DMSO	1 mM	2.5224 mL	12.6122 mL	25.2245 mL	63.0612 mL
	5 mM	0.5045 mL	2.5224 mL	5.0449 mL	12.6122 mL

源叶