



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: Ticlopidine

CAS 号: 55142-85-3

产品货号: S88133

生物活性:

生物活性:					
Description	Ticlopidine (PCR 5332) 是一种抗血栓前体, 作为非竞争性的变构 CD39 抑制剂, IC50 为 81.7 μM。Ticlopidine 阻断 NTPDase 同工酶, 对 NTPDase2 和 NTPDase3 的 IC50 分别为 170 μM 和 149 μM。Ticlopidine 是 CYP2C19 人肝细胞色素的抑制剂。Ticlopidine 抑制 CYP2C9 和 CYP3A4, IC50 值分别为 26.0 和 32.3 μM。				
IC50 & Target	CYP2CYP3				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	Platelet	IC50	3.18 μM	Antiplatelet activity in rabbit platelet rich plasma assessed as inhibition of ADP-induced platelet aggregation treated for 5 mins before ADP challenge measured for 6 mins by microplate reader	
	Platelet	IC50	3.72 μM	Antiplatelet activity in New Zealand rabbit platelet-rich plasma assessed as inhibition of ADP-induced aggregation treated for 5 mins prior to ADP-challenge measured after 1 to 6 mins by spectrophotometric analysis	
In Vitro	Ticlopidine exhibits activity against human CD39 with apparent Ki,app values of 14 μM[1].				
	Ticlopidine inhibits recombinant human CD39 expressed in COS-7-cells with the Ki value of 127±12 μM[1].				
	Growth rate is affected during the first days of culture, Ticlopidine (30 and 150 μM) reducing its effect in the following days[4]。				
	Cell Line:		Human endothelial cells		
	Concentration:		30 and 150 μM		
	Incubation Time:		2, 6; 10 days		
In Vivo	Result:		Treated cells grow slower if compared with controls and this effect correlates with the concentration of Ticlopidine in the culture medium.		
	Oral administration of Losartan with 10 mg/kg Ticlopidine significantly increases the AUC (by 65.0%), suggesting that Ticlopidine can effectively inhibit the metabolism of losartan in the intestine and/or liver[3].				
	Animal Model:		Male Sprague-Dawley rats (7-8 weeks old, weighing 270-300 g)[3]		
	Dosage:		4 or 10 mg/kg		
	Administration:		Orally administered 30 min before oral administration of losartan.		
In Vivo	Result:		The AUC and Cmax of Losartan after oral administration with Losartan and 10 mg/kg Ticlopidine were significantly greater (by 65.0% and 49.4%, respectively) than those of control rats.		
	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (379.09 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
Solvent&Solubility	Preparing	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.7909 mL	18.9545 mL	37.9089 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: shyysw@sina.com

	Stock Solutions	5 mM	0.7582 mL	3.7909 mL	7.5818 mL
		10 mM	0.3791 mL	1.8954 mL	3.7909 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 (protect from light)。-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 (9.48 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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 (9.48 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。					
参考文献	[1]. Laura Schäkel, et al. 2-Substituted thienotetrahydropyridine derivatives: Allosteric ectonucleotidase inhibitors. Arch Pharm (Weinheim). 2021 Dec;354(12):e2100300. [2]. I.KRASLOVA1, et al. Ticlopidine-Induced Cholestatic Inflammatory Hepatitis: New Insights into Pathogenetic Mechanisms of Drug-Related Hepatotoxicity. [3]. Si-hyung Yang, et al. Effects of ticlopidine on pharmacokinetics of losartan and its main metabolite EXP-3174 in rats. Acta Pharmacol Sin. 2011 Jul;32(7):967-72. [4]. F Piovella, et al. The effect of Ticlopidine on human endothelial cells in culture. Thromb Res. 1984 Feb 1;33(3):323-32.				
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 (protect from light)。-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



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	3.7909 mL	18.9545 mL	37.9089 mL	94.7724 mL
	5 mM	0.7582 mL	3.7909 mL	7.5818 mL	18.9545 mL
	10 mM	0.3791 mL	1.8954 mL	3.7909 mL	9.4772 mL
	15 mM	0.2527 mL	1.2636 mL	2.5273 mL	6.3182 mL
	20 mM	0.1895 mL	0.9477 mL	1.8954 mL	4.7386 mL
	25 mM	0.1516 mL	0.7582 mL	1.5164 mL	3.7909 mL
	30 mM	0.1264 mL	0.6318 mL	1.2636 mL	3.1591 mL
	40 mM	0.0948 mL	0.4739 mL	0.9477 mL	2.3693 mL
	50 mM	0.0758 mL	0.3791 mL	0.7582 mL	1.8954 mL
	60 mM	0.0632 mL	0.3159 mL	0.6318 mL	1.5795 mL
	80 mM	0.0474 mL	0.2369 mL	0.4739 mL	1.1847 mL
	100 mM	0.0379 mL	0.1895 mL	0.3791 mL	0.9477 mL

源叶