



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

产品名称: **Phthalazinone pyrazole**

CAS 号: **880487-62-7**

产品货号: **S88209**

生物活性:

生物活性:				
Description	Phthalazinone pyrazole 是一种有效的、选择性的、具有口服活性的 Aurora-A 激酶抑制剂,其 IC50 值为 0.031 μM。Phthalazinone pyrazole 可以阻止有丝分裂并随后通过增殖细胞的凋亡抑制肿瘤生长。Phthalazinone pyrazole 抑制人胚胎干细胞向肝细胞样细胞 (HLC) 分化过程中的上皮间质转化 (EMT)。			
	Aurora-A 0.031 μM (IC50)			
IC50 & Target				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HCT-116	IC50	7.8 μM	Cytotoxicity against human HCT116 cells after 5 days by celltiter-glo assay
In Vitro	Phthalazinone pyrazole (浓度为 1 和 10 微摩尔, 处理 30 小时) 可增强 HLCs (人肝类细胞) 的增殖能力[2]。			
	Phthalazinone pyrazole (浓度为 1、10 和 100 微摩尔, 处理 5 天) 可在不引起细胞毒性的前提下, 促进已分化的 HLCs 的肝脏形态学变化[2]。			
	Phthalazinone pyrazole (浓度为 1 和 10 微摩尔, 处理 5 天和 17 天) 通过非直接抑制 Aurora-A 的方式, 而是通过脱靶效应抑制 AKT 信号通路, 伴随上调 HNF4 α, 从而抑制 HLCs 的上皮-间质转化 (EMT) 并诱导其成熟。这一结果通过西方印迹 (Western blot) 和定量聚合酶链反应 (qPCR) 得到验证[2]。			
	Cell Proliferation Assay[2]			
	Cell Line:		Hepatocyte-like cells (HLCs)	
	Concentration:		1 and 10 μM	
	Incubation Time:		30 hours	
	Result:		Enhanced the proliferative capacity of HLCs.	
	Cell Cytotoxicity Assay[2]			
	Cell Line:		ES-HLCs, iPS-HLCs, Huh7 cells	
	Concentration:		1, 10, and 100 μM	
	Incubation Time:		5 days	
	Result:		Showed no cytotoxic effects on HLCs.	
	Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:		HLCs	
	Concentration:		1 and 10 μM	
	Incubation Time:		5 and 17 days	
	Result:		Markedly inhibited the phosphorylation of AKT and activated GSK-3β, which in turn inhibited Snail expression and increased HNF4α. Phthalazinone pyrazole didn't significantly reduce the phosphorylation of Aurora-A.	
	RT-PCR[2]			
	Cell Line:		HLCs	
Concentration:		1 and 10 μM		
Incubation Time:		5 and 17 days		



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

	Result:	Markedly inhibited the phosphorylation of AKT mRNA and activated GSK-3β mRNA, which in turn inhibited Snail mRNA expression and increased HNF4α mRNA. Phthalazinone pyrazole didn't significantly reduce the phosphorylation of Aurora-A mRNA.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 11.11 mg/mL (35.01 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				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.1512 mL	15.7560 mL	31.5119 mL
		5 mM	0.6302 mL	3.1512 mL	6.3024 mL
		10 mM	0.3151 mL	1.5756 mL	3.1512 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。					
参考文献	[1]. Prime ME, et al. Phthalazinone pyrazoles as potent, selective, and orally bioavailable inhibitors of Aurora-A kinase. J Med Chem. 2011;54(1):312-319. [2]. Choi YJ, et al. Phthalazinone Pyrazole Enhances the Hepatic Functions of Human Embryonic Stem Cell-Derived Hepatocyte-Like Cells via Suppression of the Epithelial-Mesenchymal Transition. Stem Cell Rev Rep. 2018;14(3):438-450.				
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
DMSO	1 mM	3.1512 mL	15.7560 mL	31.5119 mL	78.7799 mL
	5 mM	0.6302 mL	3.1512 mL	6.3024 mL	15.7560 mL
	10 mM	0.3151 mL	1.5756 mL	3.1512 mL	7.8780 mL
	15 mM	0.2101 mL	1.0504 mL	2.1008 mL	5.2520 mL
	20 mM	0.1576 mL	0.7878 mL	1.5756 mL	3.9390 mL
	25 mM	0.1260 mL	0.6302 mL	1.2605 mL	3.1512 mL
	30 mM	0.1050 mL	0.5252 mL	1.0504 mL	2.6260 mL