



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: **Alofanib (RPT835)**

CAS 号: **1612888-66-0**

产品货号: **S88441**

生物活性:

Description	Alofanib (RPT835)是高效和选择性的成纤维细胞生长因子受体 2 (FGFR2) 的变构抑制剂。抗癌活性。抗血管生成活性。				
IC50 & Target	FGFR2				
In Vitro	Alofanib inhibits phosphorylation of FRS2 α with IC50s of 7 and 9 nM in hFOB and SUM 52PE cells expressing different FGFR2 isoforms[1].				
	Alofanib (0.2-0.8 μ M, 6 hours) inhibits FGF-mediated proliferation in a panel of four cell lines representing several tumour types (triple-negative breast cancer, melanoma, and ovarian cancer) with GI50s of 16-370 nM[1].				
	Cell Proliferation Assay[1]				
	Cell Line:	SKOV3, HS478T, Mel Kor cells			
	Concentration:	0.2, 0.4, 0.8 μ M			
	Incubation Time:	6 hours after dosing, FGF2 is added at a concentration of 25 ng/ml			
	Result:	Inhibited growth of SKOV3 and HS578T cells with GI50s of 0.37 and 0.21 μ M. Did not potently inhibit growth of Mel Kor cells that do not contain FGFR2 (GI50>10 μ M)[1].			
In Vivo	In a FGFR-driven human tumour xenograft model, oral administration of alofanib (30 mg/kg, gavage, daily, 40 days, N=10) is well tolerated and results in potent antitumour activity[1].				
	Treatment with alofanib (10 mg/kg/d, 0, 3 and 6 d, intraperitoneally) ablates experimental FGF-induced angiogenesis in vivo[1].				
	Animal Model:	C57Bl/6 $\times$ DBA/2 F1 mice of 22–30 g[1]			
	Dosage:	10 mg/kg/d			
	Administration:	Intraperitoneally, 0, 3 and 6 d			
Result:	Alofanib inhibits angiogenesis in mouse models ^[1] .				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 30.1 mg/mL (72.81 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	2.4190 mL	12.0948 mL	24.1896 mL
		5 mM	0.4838 mL	2.4190 mL	4.8379 mL
		10 mM	0.2419 mL	1.2095 mL	2.4190 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.03 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 20.8 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。
参考文献	[1]. Tsimafeiyu I, et al. Targeting FGFR2 with alofanib (RPT835) shows potent activity in tumour models. Eur J Cancer. 2016 Jul;61:20-8. [2]. Khochonkov DA, et al. Antiangiogenic Activity of Alofanib, an Allosteric Inhibitor of Fibroblast Growth Factor Receptor 2. Bull Exp Biol Med. 2015 Nov;160(1):84-7.

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
DMSO	1 mM	2.4190 mL	12.0948 mL	24.1896 mL	60.4741 mL
	5 mM	0.4838 mL	2.4190 mL	4.8379 mL	12.0948 mL
	10 mM	0.2419 mL	1.2095 mL	2.4190 mL	6.0474 mL
	15 mM	0.1613 mL	0.8063 mL	1.6126 mL	4.0316 mL
	20 mM	0.1209 mL	0.6047 mL	1.2095 mL	3.0237 mL
	25 mM	0.0968 mL	0.4838 mL	0.9676 mL	2.4190 mL
	30 mM	0.0806 mL	0.4032 mL	0.8063 mL	2.0158 mL
	40 mM	0.0605 mL	0.3024 mL	0.6047 mL	1.5119 mL
	50 mM	0.0484 mL	0.2419 mL	0.4838 mL	1.2095 mL
	60 mM	0.0403 mL	0.2016 mL	0.4032 mL	1.0079 mL