



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: **AGX51**
CAS 号: **330834-54-3**
产品货号: **S89487**

生物活性:

Description	AGX51 是首创的 pan-Id (inhibitors of DNA-binding/differentiation proteins) 拮抗剂和降解剂。AGX51 抑制 Id1-E47 相互作用, 导致泛素介导的 Ids 降解, 细胞生长停滞和活力降低。AGX51 能抑制 TNBC, 其 IC50 值约为 25 nM。AGX51 可用于癌症的研究。																														
IC50 & Target	IC50: 26.66 μ M (4T1), 8.7 μ M (HMLE RAS Twist), 22.28 μ M (MDA-MB-157), 30.91 μ M (MDA-MB-436), 36.55 μ M (SK-BR-3), 60 μ M (MCF-7), 10.89 μ M (PDX-BR7), 11.97 μ M (PDX-IBT), 18.56 μ M (PDX-BR11)[1]																														
In Vitro	AGX51 (0-80 μ M; 24 小时) 降低 4T1 细胞中的 ID1 蛋白水平[1]。 AGX51 (40 μ M; 0-72 小时) 降低 40 μ M 的 ID1 蛋白水平 4T1 细胞浓度[1]。 AGX51 (40 μ M; 24 h) 影响 4T1 细胞、ER+、HER2+、TNBC 和三种乳腺癌 PDX 细胞基因[1]。 AGX51 (0-80 μ M; 24-48 h) 影响 4T1 细胞周期[1]。 AGX51 (40 μ M; 4-24 h) 影响 4T1 细胞中的磷酸组蛋白 H3 水平[1]。 AGX51 (40 μ M; 24 h) 影响 4T1 细胞中的 ROS 水平[1] Western Blot Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>4T1 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>0, 5, 10, 20, 40 and 80 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Decreased ID1 protein levels starting at a concentration of 40 μM in 4T1 cells.</td></tr></table> Western Blot Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>4T1 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>40 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>0, 2, 4, 8, 12, 24, 48 and 72 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Decreased ID1 protein levels starting at 4 h, while until 24 h ID1 protein completely loss.</td></tr></table> Cell Viability Assay[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>4T1 cells, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, MDA-MB-231, MDA-MB-453, BT-474, MDA-MB-361, SK-BR-3, MCF-7, T47-D, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>40 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Inhibited 4T1, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, SK-BR-3, MCF-7, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11 cell lines with IC50s of 26.66, 8.7, 22.28, 30.91, 36.55, 60, 10.89, 11.97 and 18.56 μM, respectively.</td></tr></table> Cell Cycle Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>4T1 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>40 μM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 and 48 hours</td></tr></table>	Cell Line:	4T1 cells	Concentration:	0, 5, 10, 20, 40 and 80 μ M	Incubation Time:	24 hours	Result:	Decreased ID1 protein levels starting at a concentration of 40 μ M in 4T1 cells.	Cell Line:	4T1 cells	Concentration:	40 μ M	Incubation Time:	0, 2, 4, 8, 12, 24, 48 and 72 hours	Result:	Decreased ID1 protein levels starting at 4 h, while until 24 h ID1 protein completely loss.	Cell Line:	4T1 cells, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, MDA-MB-231, MDA-MB-453, BT-474, MDA-MB-361, SK-BR-3, MCF-7, T47-D, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11	Concentration:	40 μ M	Incubation Time:	24 hours	Result:	Inhibited 4T1, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, SK-BR-3, MCF-7, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11 cell lines with IC50s of 26.66, 8.7, 22.28, 30.91, 36.55, 60, 10.89, 11.97 and 18.56 μ M, respectively.	Cell Line:	4T1 cells	Concentration:	40 μ M	Incubation Time:	24 and 48 hours
Cell Line:	4T1 cells																														
Concentration:	0, 5, 10, 20, 40 and 80 μ M																														
Incubation Time:	24 hours																														
Result:	Decreased ID1 protein levels starting at a concentration of 40 μ M in 4T1 cells.																														
Cell Line:	4T1 cells																														
Concentration:	40 μ M																														
Incubation Time:	0, 2, 4, 8, 12, 24, 48 and 72 hours																														
Result:	Decreased ID1 protein levels starting at 4 h, while until 24 h ID1 protein completely loss.																														
Cell Line:	4T1 cells, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, MDA-MB-231, MDA-MB-453, BT-474, MDA-MB-361, SK-BR-3, MCF-7, T47-D, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11																														
Concentration:	40 μ M																														
Incubation Time:	24 hours																														
Result:	Inhibited 4T1, HMLE RAS Twist, MDA-MB-157, MDA-MB-436, SK-BR-3, MCF-7, PDX-BR7, PDX-IBT and PDX-BR11 cell lines with IC50s of 26.66, 8.7, 22.28, 30.91, 36.55, 60, 10.89, 11.97 and 18.56 μ M, respectively.																														
Cell Line:	4T1 cells																														
Concentration:	40 μ M																														
Incubation Time:	24 and 48 hours																														



	Result:		Affected cell cycle of 4T1 cells with a G0/G1 phase accumulation.		
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:		4T1 cells		
	Concentration:		40 μM		
	Incubation Time:		4 and 24 hours		
	Result:		Reduced phospho-histone H3 levels in 4T1 cells.		
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:		4T1 cells		
	Concentration:		40 μM		
	Incubation Time:		24 hours		
	Result:		Increased ROS level of 4T1 cells and indicated ROS production is a main mechanism of cell killing.		
	In Vivo	AGX51 (50 mg/kg; ip 每天两次, 持续 4 周) 抑制肺转移[1]。			
AGX51 (15 mg/kg; ip 每天两次, 持续 3 周) 表现出抗-具有自发性癌症的肿瘤活动[1]。					
Animal Model:		Balb/c mice with luciferase-labeled 4T1 cells[1]			
Dosage:		50 mg/kg			
Administration:		Intraperitoneal injection; 60 mg/kg twice a day; for 4 weeks			
Result:		Inhibited lung metastasis development.			
Animal Model:		A/J mice with AOM colon tumor model[1]			
Dosage:		15 mg/kg			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (231.74 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)				
	Ethanol 中的溶解度 : 100 mg/mL (231.74 mM; 超声助溶)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3174 mL	11.5869 mL	23.1739 mL
		5 mM	0.4635 mL	2.3174 mL	4.6348 mL
		10 mM	0.2317 mL	1.1587 mL	2.3174 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 (4.82 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (4.82 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.82 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, 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 20.8 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]. Wojnarowicz PM, et al. Anti-tumor effects of an ID antagonist with no observed acquired resistance. NPJ Breast Cancer. 2021 May 24;7(1):58.
------	--

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/ Ethanol	1 mM	2.3174 mL	11.5869 mL	23.1739 mL	57.9347 mL
	5 mM	0.4635 mL	2.3174 mL	4.6348 mL	11.5869 mL
	10 mM	0.2317 mL	1.1587 mL	2.3174 mL	5.7935 mL
	15 mM	0.1545 mL	0.7725 mL	1.5449 mL	3.8623 mL
	20 mM	0.1159 mL	0.5793 mL	1.1587 mL	2.8967 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

	25 mM	0.0927 mL	0.4635 mL	0.9270 mL	2.3174 mL
	30 mM	0.0772 mL	0.3862 mL	0.7725 mL	1.9312 mL
	40 mM	0.0579 mL	0.2897 mL	0.5793 mL	1.4484 mL
	50 mM	0.0463 mL	0.2317 mL	0.4635 mL	1.1587 mL
	60 mM	0.0386 mL	0.1931 mL	0.3862 mL	0.9656 mL
	80 mM	0.0290 mL	0.1448 mL	0.2897 mL	0.7242 mL
	100 mM	0.0232 mL	0.1159 mL	0.2317 mL	0.5793 mL



源叶