



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: **Tilfrinib**
CAS 号: **1600515-49-8**
产品货号: **T85631**

生物活性:

Description	Tilfrinib (compound 4f) is a potent and selective Brk/PTK6 inhibitor with an IC50 value of 3.15 nM for Brk. Tilfrinib shows good anti-proliferative activity and has potential of anti-tumour[1][2].				
IC50 & Target	IC50: 3.15 nM (Brk), PTK6[1][2].				
In Vitro	Tilfrinib (20 μM; 36 小时) 可抑制 PTK6, 并降低 ETV4 WT 诱导的 UM-UC-3 细胞中 CXCL1 或 CXCL8 表达以及 TAN 中 VEGFA 或 MMP9 表达[1]。 Tilfrinib (化合物 4f) 对 MCF7、HS-578/T 和 BT-549 细胞表现出良好的抗增殖活性, GI50 值分别为 0.99、1.02 和 1.58 μM[2]。 Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	UM-UC-3 cells (stably expressing FLAG-ETV4 WT or Y392F)			
	Concentration:	20 μM			
	Incubation Time:	36 h			
	Result:	Reduced ETV4 WT-induced expression of CXCL1 or CXCL8 in UM-UC-3 cells and expression of VEGFA or MMP9 in TANs by inhibiting PTK6.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (454.05 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.6324 mL	18.1620 mL	36.3240 mL
		5 mM	0.7265 mL	3.6324 mL	7.2648 mL
		10 mM	0.3632 mL	1.8162 mL	3.6324 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。-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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.56 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 (7.56 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 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 (7.56 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]. Zhang Q, Liu S, et al. ETV4 mediated tumor-associated neutrophil recruitment promotes lymphangiogenesis and lymphatic metastasis of bladder cancer[J]. 2022. [2]. Mahmoud KA, et al. Discovery of 4-anilino α-carbolines as novel Brk inhibitors. Bioorg Med Chem Lett. 2014 Apr 15;24(8):1948-51.

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。-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	3.6324 mL	18.1620 mL	36.3240 mL	90.8100 mL
	5 mM	0.7265 mL	3.6324 mL	7.2648 mL	18.1620 mL
	10 mM	0.3632 mL	1.8162 mL	3.6324 mL	9.0810 mL
	15 mM	0.2422 mL	1.2108 mL	2.4216 mL	6.0540 mL
	20 mM	0.1816 mL	0.9081 mL	1.8162 mL	4.5405 mL
	25 mM	0.1453 mL	0.7265 mL	1.4530 mL	3.6324 mL
	30 mM	0.1211 mL	0.6054 mL	1.2108 mL	3.0270 mL
	40 mM	0.0908 mL	0.4541 mL	0.9081 mL	2.2703 mL
	50 mM	0.0726 mL	0.3632 mL	0.7265 mL	1.8162 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

	60 mM	0.0605 mL	0.3027 mL	0.6054 mL	1.5135 mL
	80 mM	0.0454 mL	0.2270 mL	0.4541 mL	1.1351 mL
	100 mM	0.0363 mL	0.1816 mL	0.3632 mL	0.9081 mL



源叶