

AG-1024;AG1024; Tyrphostin, AGS 200

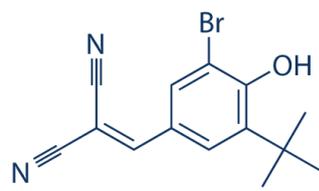
产品编号: MB4633

质量标准: >98%, 抑制 IGF-1R 自磷酸化

包装规格: 5MG; 25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C14H13BrN2O	结构式	
分子量	305.17		
CAS No.	65678-07-1		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 61 mg/mL (199.89 mM) Water Insoluble Alcohol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: AG-1024 抑制 **IGF-1R** 自磷酸化, **IC50** 为 7 μ M, 对 **IR** 作用效果稍弱, **IC50** 为 57 μ M, 且特异性区分 InsR 和 IGF-1R (相比于其他酪氨酸磷酸化抑制剂)。

别名: Tyrphostin AG 1024; 2-(3-bromo-5-tert-butyl-4-hydroxybenzylidene)malononitrile

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO 61 mg/mL (199.89 mM);Water Insoluble;Alcohol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	AG-1024 抑制 IGF-1R 自磷酸化, IC50 为 7 μ M, 对 IR 作用效果稍弱, IC50 为 57 μ M, 且特异性区分 InsR 和 IGF-1R (相比于其他酪氨酸磷酸化抑制剂)。		
靶点	IGF-1R (NIH-3T3 fibroblasts)	Insulin Receptor (NIH-3T3 fibroblasts)	
	7 μ M	57 μ M	
体外研究	AG-1024 抑制胰岛素类生长因子-1 (IGF-1) 和胰岛素刺激的细胞增殖, IC50 分别为 0.4 μ M 和 0.1 μ M, 抑制 IGF-1 受体和胰岛素受体自磷酸化, IC50 分别为 7 μ M 和 57 μ M, 也抑制受体酪		

	<p>氨酸激酶作用于外源底物(TKA)的活性, IC50 分别为 18 μM 和 80 μM。AG-1024 (10 μM)作用于 MCF-7 细胞, 处理 48 小时, 抑制细胞增殖, 这种作用存在时间依赖性, 且诱导细胞凋亡, 凋亡率为 20.1%, 与 Irradiation (10 Gy)联用时, 凋亡率达 40% 以上, Irradiation (10 Gy)单独作用时凋亡率仅为 11.8%, 与 p-Akt1 和 bcl-2 的下调,及 Bax, p53 和 p21 的上调相关。在有血清存在时, 通过抑制 MAPK/ERK2 信号通路, 随后快速诱导 pRb 去磷酸化, 最后抑制 pRb-E2F 复合体形成, AG-1024 显著抑制恶性黑色素瘤细胞增殖, IC50<50 nM。AG-1024 作用于 UT7-9 和 Ba/F3-p210 细胞, 下调 Bcr-Abl 和 P-Akt 表达,也上调 DNA-PKcs 表达, 导致克隆基因存活和增殖下降。AG-1024 也显著抑制抗 BCR-ABL 抑制剂 STI571 的细胞增殖, 与 Bcr-Abl 蛋白表达的剂量依赖性降低相关。</p>
体内研究	<p>与 AG-1024 的体外抗癌效果一致, AG-1024 按 30 μg 剂量处理携带 Ba/F3-p210 移植瘤的小鼠, 处理 10 天, 显著抑制肿瘤生长。</p>

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4627	BMS-536924
MB3905	BMS-754807
MB3908	GSK1838705A

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。Vilanterol (GW642444; GW 642444X)是吸入型长效 β 2 激动剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

浓度	DMSO 质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2769 mL	16.3843 mL	32.7686 mL
5 mM	0.6554 mL	3.2769 mL	6.5537 mL
10 mM	0.3277 mL	1.6384 mL	3.2769 mL
50 mM	0.0655 mL	0.3277 mL	0.6554 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>IGF-1 和胰岛素刺激的细胞增殖抑制实验:</p> <p>过量表达 IGF-1 或胰岛素受体的 NIH-3T3 细胞接种在 96 孔板上(每孔 2,000-5,000 个细胞), 在完全培养基中过夜。细胞转移到含 1% FBS 的 DMEM 培养基上, 在 10 nM IGF-1 或胰岛素存在时, 加入不同浓度 AG-1024 反应 120 小时。每 48 小时更换一次培养基。在指定时间, 从每孔中吸出培养基, 然后每孔加入 100 μL MTT。然后细胞在 37$^{\circ}$C 下温育 4 小时, 加入 100 μL 异戊醇溶解, 震荡 20 分钟。使用 ELISA 读数器在 570 和 690 nm 处读数, 在 120 小时时间点测定 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: MCF-7 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为 10 μM Incubation Time: 24, 48 或 72 小时 Method: 用 AG-1024 处理细胞 24, 48 或 72 小时。为了测定增殖, 获得细胞, 用台酚蓝染色排除法计数。通过荧光素 anti-digoxigenin 修饰的 MCF-7 和碘化丙啶双染色而测评细胞凋亡。用 PBS 清洗固定的细胞, 用 TdT 酶和 Dig-dUTP 清洗悬浮在 TdT buffer 细胞, 持续 60</p>

	分钟，用 anti-Dig-Fluorescein 清洗悬浮在 FITC 阻断溶液中的细胞，黑暗环境下持续 30 分钟。然后用缓冲液清洗细胞，再次悬浮在碘化丙啶/RNase A 溶液中，持续 30 分钟，然后通过流式细胞仪分析。溶解细胞，通过 Western Blot 分析，测定 p-Akt1, Bax, p53, bcl-2 和 p21。
动物实验	Animal Models: 皮下注射 Ba/F3-p210 细胞的雌性裸鼠 Formulation: 溶于 DMSO,然后用 PBS 稀释 Dosages: 30 µg/day Administration: 腹膜注射

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会严重影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于500MG的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在200转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。