

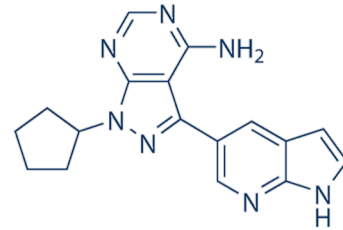
## PP121 (PDGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF5310-10mM	PP121 (PDGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5310-5mg	PP121 (PDGFR抑制剂)	5mg
SF5310-25mg	PP121 (PDGFR抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	1-cyclopentyl-3-(1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-5-yl)pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-amine
简称	PP121
别名	1-cyclopentyl-3-(1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-5-yl)-1H-pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-amine, PP 121, PP-121, ChEMBL1081312
中文名	N/A
化学式	C <sub>17</sub> H <sub>17</sub> N <sub>7</sub>
分子量	319.36
CAS号	1092788-83-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 64mg/ml; Ethanol 2mg/ml
溶液配制	5mg加入1.57ml DMSO, 或每3.19mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF5310-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PP121是一种作用于PDGFR、Hck、mTOR、VEGFR2、Src和Abl的多靶点抑制剂, IC <sub>50</sub> 分别为2nM、8nM、10nM、12nM、14nM和18nM, 也抑制DNA-PK, IC <sub>50</sub> 为60nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	PDGFR	Hck	VEGFR	mTOR	Src
IC <sub>50</sub>	2nM	8nM	12nM	13nM	14nM
体外研究	PP-121在酪氨酸激酶和PI3Ks而不是丝-苏氨酸激酶保守的疏水性口袋中选择性相互作用。PP-121在Src处与Glu310形成氢键, 有效取代催化赖氨酸的结构作用, 且导致产生螺旋C的顺序和活性构象的稳定性。PP-121抑制一些PI3Ks, 包括p110α、DNA-PK和mTOR, IC <sub>50</sub> 分别为52nM、60nM和10nM。PP-121抑制一些酪氨酸激酶, 包括 Bcr-Abl、Hck、Src、VEGFR2和PDGFR, IC <sub>50</sub> 分别为18nM、8nM、14nM、12nM和2nM。PP-121浓度为0.04到10μM时, 作用于两种胶质瘤细胞系, U87和LN229。有效抑制Akt、p70S6K和S6磷酸化, 这种作用存在剂量依赖性。PP-121浓度为0.04到10μM时, 通过直接对PI3Ks和mTOR抑制, 而有效抑制一系列肿瘤细胞增殖。PP-121作用于LN220、U87和Seg1细胞, 诱导细胞在G0/G1期停滞。PP-121浓度为0.08到20μM时, 作用于转化v-Src(Thr338)的NIH3T3细胞, 抑制v-Src诱导的酪氨酸磷酸化。PP-121浓度为2.5μM时, 作用于转化v-Src(Thr338)的NIH3T3细胞, 恢复肌动蛋白纤维的染色。PP-121浓度低到40nM时, 作用于表达C634W致癌基因Ret突变35的TT甲状腺癌细胞, 抑制Ret自磷酸化。PP-121抑制TT甲状腺癌细胞增殖, IC <sub>50</sub> 为50nM。PP-121作用于人脐静脉内皮细胞(HUVECs), 抑制VEGF刺激的细胞增殖, IC <sub>50</sub> 为41nM。PP-121直接抑制Bcr-Abl诱导的酪氨酸磷酸化, 作用于K562细胞, 导致产生药物诱导的凋亡, 而作用于表达Bcr-Abl的BaF3细胞, 诱导凋亡, 且诱导细胞周期停滞。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	在10μM ATP, 2.5μCi γ-32P-ATP和底物存在时, 纯化的激酶域与PP-121的2或4倍稀释液(浓度范围为

	1nM-50μM)或0.1% DMSO(空白对照)温育。通过点样到硝酸纤维素膜或磷酸纤维素膜上终止反应, 然后冲洗膜5-6次, 移除未结合的放射性, 然后烘干。通过磷光法量化放射性, 然后使用Prism软件, 拟合数据到S型剂量反应, 而计算IC50值。
--	---

细胞实验	
细胞系	U87, LN229, NIH3T3, HUVECs, BaF3和TT甲状腺癌细胞
浓度	0.04μM-10μM
处理时间	24-72小时
方法	用于western blot分析时,细胞生长在12孔板中, 然后使用指定浓度PP-121或0.1% DMSO处理。处理的细胞裂解, 裂解物使用SDS-PAGE溶解, 然后转移到硝酸纤维素上进行印迹。细胞增殖研究中, 细胞生长在96孔板上, 使用PP-121的4倍稀释液(10μM-0.040μM)或0.1% DMSO处理。72小时后, 使用Resazurin钠盐(22μM)处理细胞, 然后测定荧光。使用Prism软件测定IC50值。细胞增殖研究中, 涉及计数单细胞, 非粘着细胞按低密度(3-5%汇合度)接种, 然后使用PP-121(2.5μM)或0.1% DMSO处理。每天细胞稀释到台酚蓝中, 然后使用血球计数仪测定活细胞数。细胞凋亡和细胞周期研究中, 使用指定浓度 PP-121或0.1% DMSO处理细胞24-72小时。使用AnnexinV-FITC对细胞进行染色, 或使用乙醇固定, 然后使用碘化丙啶染色。使用FacsCalibur流式细胞仪分开细胞群, 使用CellQuest Pro软件收集数据, 然后使用ModFit或FlowJo软件分析。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

1. Apsel B, et al. Nat Chem Biol, 2008, 4(11), 691-699.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF5310-10mM	PP121 (PDGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF5310-5mg	PP121 (PDGFR抑制剂)	5mg
SF5310-25mg	PP121 (PDGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01