产品名称：**AZ191**
产品别名：**AZ191**

生物活性：

Description	AZ191 is a potent inhibitor that selectively inhibits DYRK1B with IC50 of 17 nM[1].
IC_{50} & Target	IC50: 17 nM (DYRK1B)[1]
In Vitro	AZ191 (0.01-60μM; 5 days) inhibits SW872 and SW982 cell lines in dose-dependent manner with IC50s of 3.183 μM and 1.279 μM, respectively[2]. AZ191 (1-5 μM; 48 hours) down-regulates three anti-apoptotic proteins (Bcl-2, p21, and survivin) at higher concentrations[2].

Cell Proliferation Assay[2]

Cell Line:	SW872, SW982 liposarcoma cells
Concentration:	0.01, 0.03, 0.1, 0.3, 0.6, 1, 3, 6, 10, 20, 60 μM
Incubation Time:	5 days
Result:	Dose-dependent growth inhibition with IC_{50}s of 3.183 μM and 1.279 μM for SW872 and SW982 cell lines, respectively.

Western Blot Analysis[2]

Cell Line:	SW872, SW982 liposarcoma cells
Concentration:	1, 2, 3, 4, 5 μM
Incubation Time:	48 hours
Result:	Down-regulated three anti-apoptotic proteins (Bcl-2, p21, and survivin) at higher concentrations.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 30 mg/mL (69.85 mM)

H_2O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.3282 mL	11.6409 mL	23.2818 mL
	5 mM	0.4656 mL	2.3282 mL	4.6564 mL
	10 mM	0.2328 mL	1.1641 mL	2.3282 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。

In Vivo:

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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM); Clear solution

	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。 2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: 2.5 mg/mL (5.82 mM); Suspended solution; Need ultrasonic 此方案可获得 2.5 mg/mL (5.82 mM)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 25.0 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。
References	[1]. Ashford AL, et al. A novel DYRK1B inhibitor AZ191 demonstrates that DYRK1B acts independently of GSK3β to phosphorylate cyclin D1 at Thr(286), not Thr(288). Biochem J. 2014 Jan 1;457(1):43-56. [2]. Chen H, et al. Targeting DYRK1B suppresses the proliferation and migration of liposarcoma cells. Oncotarget. 2017 Nov 28;9(17):13154-13166.