



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: **PT-2385**
产品别名: **PT-2385**

生物活性:

Description	PT-2385 is a selective HIF-2α inhibitor with a Ki of less than 50 nM[1][2].				
IC ₅₀ & Target	Kd: <50 nM (HIF-2α)[1]				
In Vitro	PT-2385 (PT2385) is a selective antagonist of HIF-2 over HIF-1. PT-2385 is inactive for HIF-1α[1].				
In Vivo	PT-2385 (30 or 100 mg/kg; oral gavage; twice daily) result in a rapid, dose-dependent tumor regression[3]. PT-2385 (PT2385) inhibits expression of HIF-2α regulated genes in a dose dependent manner in vivo. Tumor is regressed with PT-2385 (3 and 10 mg/kg, p.o., b.i.d. dose) in 786-O xenograft. PT-2385 (1,3 and 10 mg/kg) also inhibits tumor-derived VEGFA protein levels. PT-2385 (10 mg/kg) treatment reduces proliferation (Ki67) and angiogenesis (CD-31)[1].				
	Animal Model:	SCID/beige mice with the 786-O and A498 RCC cell lines[3]			
	Dosage:	30 or 100 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; twice daily			
	Result:	Resulted in a rapid, dose-dependent tumor regression.			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 50 mg/mL (130.43 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	Preparing Stock Solutions	<div>SolventMassConcentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.6087 mL	13.0433 mL	26.0865 mL
		5 mM	0.5217 mL	2.6087 mL	5.2173 mL
		10 mM	0.2609 mL	1.3043 mL	2.6087 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℃，6 months; -20℃，1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 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 (6.52 mM); Clear solution				
	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.52 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)					



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

	<p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.52 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.52 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>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。</p> <p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO \rightarrow 90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.52 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.52 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>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 玉米油中, 混合均匀。</p>
References	<p>[1]. Eli Wallace, Ph.D. PT2385: HIF-2α Antagonist for the Treatment of VHL Mutant ccRCC. 12th International VHL Medical Symposium April 8, 2016.</p> <p>[2]. Xie C, et al. Activation of intestinal hypoxia-inducible factor 2α during obesity contributes to hepatic steatosis. Nat Med. 2017 Nov;23(11):1298-1308.</p> <p>[3]. Wallace EM, et al. A Small-Molecule Antagonist of HIF2α Is Efficacious in Preclinical Models of Renal Cell Carcinoma. Cancer Res. 2016 Sep 15;76(18):5491-500.</p>

源叶生物