

AG-490

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	51901ES10	10 mg
AG-490	51901ES50	50 mg
	51901ES60	100 mg

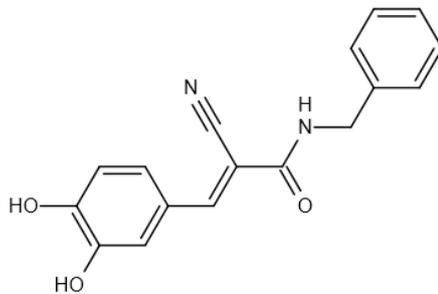
产品描述

AG-490 (AG490; AG 490; Tyrphostin AG490; Tyrphostin B42; Zinc02557947; Zinc 02557947)是一种 JAK2/EGFR 抑制剂和酪氨酸磷酸化抑制剂, 抑制 EGFR 靶点(IC₅₀=0.1 μM), 并抑制 JAK2 活性(IC₅₀=10 μM)。AG 490 有效抑制 IL-2 诱导的 T 细胞增殖, 而且显著抑制酪氨酸磷酸化和 DNA-转录因子结合活性, 如 STAT1, -3, -5a, -5b。另外, 通过诱导程序性细胞死亡, AG 490 选择性抑制体内外白血病细胞生长, 但对正常造血作用无有害影响。AG 490 抑制多发性骨髓瘤(MM)细胞增殖, 诱导细胞凋亡。AG-490 抑制 Stat3sm 组成型激活, 且抑制自发的或 IL-2 诱导的 MF 肿瘤细胞生长。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Tyrphostin AG490; Tyrphostin B42; Tyrphostin AG-490; Zinc02557947; AG490; AG 490; α-Cyano-(3,4-dihydroxy)-N-benzylcinnamide; (E)-N-benzyl-2-cyano-3-(3,4-dihydroxyphenyl) prop-2-enamide
中文名称 (Chinese Name)	JAK2/EGFR 抑制剂; 酪氨酸磷酸化抑制剂; (E)-N-苯基-2-氰基-3-(3,4-二羟基苯基)丙烯酰胺
靶点 (Target)	EGFR; STAT; Autophagy
通路 (Pathway)	JAK/STAT -- EGFR
CAS 号 (CAS NO.)	133550-30-8
分子式 (Formula)	C ₁₇ H ₁₄ N ₂ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	294.3
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

AG-490 以剂量依赖性方式消除了 IL-2 诱导型^[3H]胸苷的掺入，IC₅₀ 为 25 μM。AG-490 有效抑制 IL-2 介导的 T 细胞增殖，而对丝裂原刺激的正常 T 细胞的生长没有明显影响。AG-490 剂量为 10 μM 时，Stat-3 磷酸化降低>95%，并保持细胞活力。10 μM 剂量的 AG490 导致 EGF 刺激的 A431 细胞中 pStat-3 降低>95%，而对 Stat-3 质量没有影响。^[1] 为检测 AG 490 对 MF 细胞的作用，AG 490 (0-100 μM) 孵育 MF 细胞，当浓度超过 50 μM 时，抑制 MF 细胞自发生长(IC₅₀=75 μM)，而低浓度时可以抑制 IL-2 诱导的 MF 细胞生长。^[4]

（二）动物实验（体内实验）

AG490 显著抑制 1 型糖尿病(T1D)的发展（在两个不同的时间点，p=0.02，p=0.005）。AG490（1 mg/小鼠）对新诊断的糖尿病 NOD 小鼠进行单药治疗后显著使治疗动物（n = 23）的疾病缓解。^[2] AG490 (1-10 μg)以剂量依赖性方式显著减轻 β-角叉菜胶诱导的热痛觉过敏。AG490 还可以减轻机械性痛觉过敏。^[3]

参考文献

- [1] Wang LH, et al. JAK3, STAT, and MAPK signaling pathways as novel molecular targets for the tyrophostin AG-490 regulation of IL-2-mediated T cell response. *J Immunol.* 1999 Apr 1;162(7):3897-904.
- [2] Davoodi-Semiromi A, et al. The tyrophostin agent AG490 prevents and reverses type 1 diabetes in NOD mice. *PLoS One.* 2012;7(5): e36079.
- [3] Cheppudira BP, et al. Anti-hyperalgesic effects of AG490, a Janus kinase inhibitor, in a rat model of inflammatory pain. *Biomed Rep.* 2015 Sep;3(5):703-706.
- [4] Nielsen M., et al. Constitutive activation of a slowly migrating isoform of Stat3 in mycosis fungoides: tyrophostin AG490 inhibits Stat3 activation and growth of mycosis fungoides tumor cell lines. *Proc Natl Acad Sci USA.* 94: 6764-6769 (1997).