

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	K10012
产品名称:	KYA1797K

产品简介:

一种有效, 选择性的 Wnt/ β -catenin 抑制剂, IC ₅₀ 值为 0.75 μ M。	
靶点:	IC ₅₀ : 0.75 (Wnt/ β -catenin)
体外研究:	
KYA1797K 直接结合 axin 的 G 蛋白信号域的调节剂, 通过增强激活 GSK3 β 的 β -连环蛋白破坏复合物启动 β -连环蛋白和 Ras 降解。KYA1797K 有效抑制携带 APC 和 KRAS 突变的 CRC 的生长。KYA1797K 增强 β -catenin 破坏复合物的形成并诱导 GSK3 β 激活, 导致 β -catenin 和 K-Ras 在 S33/S37/T41 和 T144/T148 磷酸化。KYA1797K 以剂量依赖性方式降解 β -连环蛋白和 Ras SW480、LoVo、DLD1 和 HCT15 细胞。KYA1797K 使表达 WT β -连环蛋白或 WT K-Ras 的 DLD1 细胞中的 β -连环蛋白和 Ras 不稳定。	
体内研究:	
KYA1797K 显著抑制携带 APC 和 K-Ras 突变的 CRC 细胞异种移植小鼠以及 Apc ^{min/+} /Kras ^{G12D} LA2 小鼠模型中的肿瘤大小。KYA1797K (25 mg/kg) 可使肿瘤的重量和体积减少 70%。KYA1797K 处理可显著降低 β -连环蛋白和 Ras 蛋白以及 Wnt/ β -连环蛋白和 Ras 信号转导靶标的水平。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 溶于 DMSO (2mg/mL 加热)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.2598 mL	11.2992 mL	22.5984 mL
5 mM	0.4520 mL	2.2598 mL	4.5197 mL
10 mM	0.2260 mL	1.1299 mL	2.2598 mL
储备液的保存方式: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline Solubility: 1 mg/mL (2.26 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 1 mg/mL 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 μ L 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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: 1 mg/mL (2.26 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 1 mg/mL 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 μ L 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液中, 混合均匀。			



2 g SBE- β -CD (磺丁基醚 β -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

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、以上信息仅做参考交流之用。

储存： -20℃

