

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	M11250
产品名称:	ML264

产品简介:

一种有效和选择性的 Kruppel 样因子 5 (KLF5) 表达抑制剂。ML-264 is a Kruppel-like factor 5 (KLF5) inhibitor That Potently Inhibits Growth of Colorectal Cancer. ML264 is highly active (IC50 = 29 nM is a cell-based assay for proliferation of DLD-1 cells, IC50 = 81 nM in a cell-based luciferase assay). It lacks cytotoxicity in the IEC-6 control cell line (IC50 >50 μM, <50% inhibition was observed at 100 μM). Robust activity was also seen in several other KLF5-expressing cell types as well (e.g., HCT116, IC50 = 560 nM; HT29, IC50 = 130 nM; SW620, IC50 = 430 nM). ML264 is a good candidate for in vivo anticancer studies, with great potential for use in long time-course in situ studies aimed to elucidate the role of KLF5 as a regulator of cellular proliferation and tumor formation in the intestinal epithelium.

靶点: KLF5

体外研究:

ML264 具有高活性 (IC50=29 nM 是基于细胞的 DLD-1 细胞增殖测定, IC50=81 nM 在基于细胞的荧光素酶测定中)。ML264 在 IEC-6 对照细胞系中缺乏细胞毒性 (IC50>50 μM, 在 100 μM 时观察到 <50% 的抑制作用)。在其他几种表达 KLF5 的细胞类型中也观察到强大的活性 (例如, HCT116, IC50=560 nM; HT29, IC50=130 nM; SW620, IC50=430 nM)。Western blot 分析表明, ML264 显著降低了 KLF5 的表达。

在 72 小时内测试了 ML264 对结肠癌细胞系 DLD-1 和 HCT116 的细胞增殖率的影响。ML264 有效抑制两种细胞系的增殖率。处理后 24 小时内增殖明显减少, 到 72 小时, ML264 处理的细胞和载体处理的细胞的活细胞数量相差 15 至 30 倍。执行允许对代谢活性细胞进行量化的 MTS 测定。ML264 处理显著减少了 DLD-1 细胞在 24、48 和 72 小时时进行有丝分裂的细胞数量。

体内研究:

每天单次注射 10 mg/kg 的 ML264 不会显著影响肿瘤生长。然而, 每天两次以 10 mg/kg 或 25 mg/kg 的剂量注射 ML264 会导致肿瘤生长显著减少, 并且这种效果最早可在第一次注射后两天检测到。数据还显示 ML264 对肿瘤体积有浓度依赖性影响。肿瘤生长的统计分析显示, 与在第 5 天和第 10 天仅接受载体的小鼠相比, 每天两次接受 ML264 处理的小鼠的肿瘤大小显著减小。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 溶于 DMSO (≥100mg/ml)

浓度	质量			
	溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM		2.5982 mL	12.9911 mL	25.9821 mL
5 mM		0.5196 mL	2.5982 mL	5.1964 mL
10 mM		0.2598 mL	1.2991 mL	2.5982 mL

储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year.



二：体内实验

1、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 3.25 mg/mL (8.44 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 3.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 32.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

2、请依序添加每种溶剂： 15% Cremophor EL→85% Saline

Solubility: 10 mg/mL (25.98 mM); 悬浊液; 超声助溶

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。

三、细胞实验

细胞系: DLD-1 和 HCT116 (结肠癌细胞株)

浓度: 10 μ M

处理时间: 24, 48, 72h

方法: 对于细胞增殖实验, DLD-1 和 HCT116 细胞处理以 10 μ M ML264 或 DMSO, 孵育 24、48 和 72 小时后, 每孔中加入 20 μ L 的 MTS 溶液, 随后进行检测分析。

四、动物实验

动物模型: 注射了 DLD-1 细胞以成瘤的裸鼠

剂量: 10 or 25 mg/kg

给药处理: 腹腔注射

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°C

