

BPTES

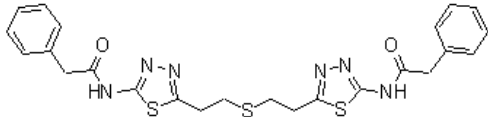
产品编号：MB2348

质量标准：>97%,选择性 Glutaminase GLS1 (KGA)抑制剂

包装规格：5MG;10MG

产品形式：白色至米色粉末

基本信息

分子式	C24H24N6O2S3	结构式	
分子量	524.68		
CAS No.	314045-39-1		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 10 mg/mL Water : Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：BPTES 是一种有效的 glutaminase 抑制剂，用于癌症研究。

别名：Bis-2-(5-phenylacetamido-1,3,4-thiadiazol-2-yl)ethyl sulfide

物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

溶解性：.....DMSO: 10 mg/mL ; Water : Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量：.....>97%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	BPTES 是一种有效的选择性 Glutaminase GLS1 (KGA)抑制剂，其 IC₅₀ 为 0.16 μM。它对谷氨酸脱氢酶的活性没有影响，对 γ 谷氨酰转肽酶的活性只有很微弱的抑制作用。
靶点	Glutaminase GLS1 (KGA) 0.16 μM
体外研究	BPTES 抑制谷氨酰胺酶，在人肾脏细胞中 IC ₅₀ 为 0.18 μM，并通过小胶质细胞抑制谷氨酸盐，IC ₅₀ 为 80-120 nM。含有突变型 IDH1 的 D54 细胞中，BPTES 优先减慢其细胞生长。BPTES 也会抑制谷氨酰胺酶活性，降低谷氨酸盐和 α-KG 水平，并增加糖酵解的中间产物。BPTES (10 μM)抑制衍生自 LAP/MYC 肿瘤的 mHCC 3-4 细胞的生长。BPTES 也会通过阻断 DNA 复制，导致细胞死亡和裂解，从而抑制 MYC 依赖性 P493 细胞的生长
体内研究	在 LAP/MYC 小鼠中，BPTES (12.5 mg/kg, i.p.)延长存活期，而对 MYC，GLS，或 GLS2 水平没有显著作用。在负荷 P493 肿瘤异种移植物的 小鼠中，BPTES (200 μg/mouse, i.p.)也会抑制肿瘤细胞生长。

用途及描述 :科研试剂,广泛应用于分子生物学,药理学等科研方面,严禁用于人体。BPTES 是谷氨酰胺酶 GLS1 (KGA) 的选择性抑制剂,发现于肾脏和脑,并且被 myc 正向调节,在很多肿瘤和肿瘤细胞系中强烈表达。谷氨酰胺酶将谷氨酰胺转化为谷氨酸,谷氨酸是大脑中一种重要的兴奋性神经递质,可进一步氧化为 α -酮戊二酸以供三羧酸(TCA)循环使用,并转化为谷胱甘肽,这对于控制活性氧(ROS)的含量非常重要。对癌细胞生长具有重要意义。BPTES 对胶质瘤细胞生长有抑制作用。BPTES 是一种具有 $3\mu\text{M}$ K_i 的非竞争性抑制剂。

储液配置

体 质 量 浓 度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9059 mL	9.5296 mL	19.0592 mL
5 mM	0.3812 mL	1.9059 mL	3.8118 mL
10 mM	0.1906 mL	0.9530 mL	1.9059 mL
50 mM	0.0381 mL	0.1906 mL	0.3812 mL

经典实验操作 (仅供参考)

酶实验 :	谷氨酰胺酶抑制:无细胞试验: 试验板中每孔包含 2 μL 测试化合物的 DMSO 溶液。酶在谷氨酰胺酶试验缓冲液中稀释为 1 unit (肝脏)或 0.8 unit (肾脏)/100 μL, 并通过多支路将 100 μL 稀释的酶加入测定板的每孔中。将所有成分在 TiterMix 100 上全速摇晃 1 分钟混合。板在室温(RT)下预培养 20 分钟,使测试化合物结合到谷氨酰胺酶,50 μL 谷氨酸盐溶液(在测定缓冲液中浓度为 7 mM)通过多支路加入每孔。将所有成分在 TiterMix 100 上全速摇晃 30 秒,然后板在 RT 下培育 60 分钟(肝脏)或 90 分钟(肾脏)。为停止反应,20 μL HCl (0.3 N)通过多支路加入每孔,然后立即在 TiterMix 100 上摇晃 30 秒混合。对于定量,谷氨酸盐(通过谷氨酰胺酶催化谷氨酰胺水解形成)通过第二种酶,谷氨酸脱氢酶(GDH),被氧化为 2-氧化戊二酸,并伴随烟酰胺腺嘌呤二核苷酸(NADH)的还原型产物。在试验溶液中 NADH 对硝基蓝四氮唑(NBT)的还原被吩嗪硫酸甲酯(PMS)催化,导致蓝紫色甲臌的形成。甲臌在 540 nm 下的吸光度与高达 200 μM 的谷氨酸盐浓度呈线性比例。NBT/GDH 试剂(50 μL)通过多支路加入每孔,在 TiterMix 100 上摇晃 30 秒混合,板在 RT 下培育 20 分钟以允许 GDH 反应中颜色形成。谷氨酸盐浓度根据在 SpectraMax 340 上读取 OD540 得到的甲臌浓度测定。
细胞实验 :	Cell lines: D54 细胞 Concentrations: -- Incubation Time: 48 小时 Method: 细胞生长试验使用 alamarBlue 进行。细胞以 500 细胞/孔的密度接种在 96 孔黑色透明底板。24 小时后,培养基更换为合适的培养基(DMEM 与 4.5 g/L,1.5 g/L 或 0.1 g/L 葡萄糖,10% FBS,青霉素/链霉素,和 4 mM 谷氨酸盐,包含或不包含 doxycycline)。接种 48 小时后,加入化合物或者 DMSO。每孔加入 200μL 体积的培养基和 alamarBlue。荧光性在 48 小时 (AOA, BPTES)使用 Victor3 酶标仪测量。
动物实验 :	Animal Models: LAP/MYC 小鼠 Formulation: 包含 10% DMSO 的 PBS Dosages: 12.5 mg/kg

	Administration: i.p.
--	----------------------

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。