

## Wnt-C59 (C59)

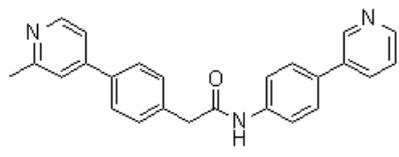
产品编号: MB4051

质量标准: >98%

包装规格: 5MG;25MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C25H21N3O	结 构 式	
分子量	379.45		
CAS No.	1243243-89-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 76 mg/mL (200.28 mM) 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:** Wnt-C59 (C59)是高效口服的 PORCN 抑制剂。

**别名:** C59; Benzeneacetamide, 4-(2-methyl-4-pyridinyl)-N-[4-(3-pyridinyl)phenyl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....类白色至卡其色固体

溶解性: .....DMSO: 76 mg/mL (200.28 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量: .....>98%

**储存条件:** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Wnt-C59 (C59)是 PORCN 抑制剂, 作用于 Wnt3A-调节的多聚 TCF 结合位点驱动的荧光素酶的激活, IC50 为 74 pM。
<b>靶点</b>	PORCN
<b>IC50</b>	74 pM
<b>体外研究</b>	Wnt-C59 (C59)在纳摩尔浓度时抑制 PORCN 酶活性。Wnt-C59(10 nM)作用于转染 WNT3A-V5 或 WNT8A-V5 质粒的 HeLa 细胞, 抑制 Palmitoylation 依赖性的 Wnt-WLS 互动。Wnt-C59 (100 nM)作用于转染 WNT3A-V5 的 HeLa 细胞, 抑制 Palmitate 合并到 WNT3A, 与此一致的是, PORCN 活性受抑制。Wnt-C59 (100 nM)作用于转染 PORCN 的无 PORCN HT1080 细胞抑制所有小鼠 PORCN 剪接变异体的活性。Wnt-C59 在纳摩尔水平抑制哺乳动物 PORCN 酰基转移酶活性, 且抑制所有人类 Wnts 激活。Wnt-C59 在体外按完全抑制 PORCN 的浓度处理, 不显著抑制 46 种实验癌细胞系增殖。Wnt-C59 处理 NMuMG(NMG) 细胞, 显著抑制增殖, 与 ICG-001 差不多。Wnt-C59 作用于 NMuMG(NMG)细胞, 抑制三倍球体形成,

	这依赖于 Wnt10b 的分泌。Wnt-C59 抑制 50% 以上的人类 MDA-MB 231 细胞增殖。Wnt-C59 (Porcupine 抑制剂) 作用于转染 Flag-Porcupine 的小鼠 L-Wnt3a 细胞, 抑制 [125I]iodo-pentadecanoate 的放射性标签形成。
<b>体内研究</b>	Wnt-C59 按 5 mg/kg 剂量单独口服处理给药小鼠, 至少 16 小时后, 浓度维持大于体外 IC50 的 10 倍以上。Wnt-C59(10 mg/kg) 作用于原位移植独立性 MMTV-WNT1 肿瘤的雌性裸鼠, 抑制 MMTV-WNT1 肿瘤生长。Wnt-C59 (10 mg/kg) 作用于原位移植独立性 MMTV-WNT1 肿瘤的雌性裸鼠, 通过降低 $\beta$ -catenin 靶向基因的表达, 降低 Wnt 通路活性, 且降低 MMTV-WNT1 肿瘤增殖。Wnt-C59(10%) 局部给药处理成年 K14CREER/Rosa-SmoM2 小鼠, 处理 4 周, 降低表达 SmoM2 的细胞的发育异常尺寸。

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB4120	IWP-L6
--------	--------

**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。Wnt-C59 (C59) 是高效可口服的 **PORCN** 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6354 mL	13.1770 mL	26.3539 mL
5 mM	0.5271 mL	2.6354 mL	5.2708 mL
10 mM	0.2635 mL	1.3177 mL	2.6354 mL
50 mM	0.0527 mL	0.2635 mL	0.5271 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> NMuMG(NMG) 和 MDA-MB 231 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> --</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 细胞按每孔 <math>4 \times 10^3</math> 个接种在 100 <math>\mu</math>L 含 Wnt-C59 的培养基中。细胞在 37°C 下温育 48 小时。每孔加入 10 <math>\mu</math>L 细胞增殖试剂, 在 37°C 下温育 4 小时。在摇床上充分震荡 1 分钟。使用 ELISA 酶标仪测量样品的吸光度。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 原位移植独立性 MMTV-WNT1 肿瘤的雌性裸鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 0.5% 甲基纤维素和 0.1% Tween-80</p> <p><b>Dosages:</b> 10 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理</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。如需制备储备液, 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, 使产品沉降到管底。对于液体产品, 可以在 200 转左右稍作离心, 管底收集液体, 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。