

KYA1797K

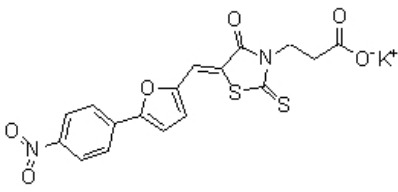
产品编号：MB4593

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C17H11N2O6S2.K	结 构 式	
分子量	442.51		
CAS No.	1956356-56-1		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO：29 mg/mL (65.53 mM)		
	Water：29 mg/mL (65.53 mM)		
	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：KYA1797K 是有效，选择性的 Wnt/β-catenin 抑制剂。

别名：3-Thiazolidinepropanoic acid, 5-[[5-(4-nitrophenyl)-2-furyl]methylene]-4-oxo-2-thioxo-, potassium salt (1:1), (5Z)-

物理性状及指标：

外观：.....类白色至橘色固体

溶解性：.....DMSO：29 mg/mL (65.53 mM)；Water：29 mg/mL (65.53 mM)；Ethanol：Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

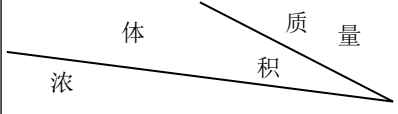
产品描述	KYA1797K 是一种有效的、高度选择性的 Wnt/ β -catenin 抑制剂，在 TOPflash 实验中，IC50 为 0.75 μ M。
靶点	Wnt/ β -catenin(in HEK293 cells) 0.75 μ M
体外研究	KYA1797K 显著降低了 Wnt/ β -catenin 和 MAPK/ERK pathways 信号通路的报告基因的活性，但对其他癌症相关信号通路无影响，如 Notch、TGF β 信号通路。因此，KYA1797K 选择性地调节 Wnt/ β -catenin 和 Ras/ERK 通路。KYA1797K 增强 β -catenin 与内源性 axin、GSK3 β 、 β -TrCP 的结合亲和力，而 APC 和 β -catenin 的相互作用并没有被 KYA1797K 所增强。它能促进 β -catenin 破坏复合体的形成。KYA1797K 在这些细胞中(CRC 细胞系 SW480, LoVo, DLD1 和 HCT15 细胞) 以剂量依赖方式降解 β -catenin 和 Ras。KYA1797K 的处理同样也会抑制细胞增殖。KYA1797K 主要通过干扰 β -catenin 的稳定性以及降解 Ras 来抑制 CRC 细胞的增殖。KYA1797K 能直接靶向 axin、调节 β -catenin 破坏复合体的构象。
体内研究	在具 APC 和 KRAS 突变的异种移植瘤的小鼠中，通过腹腔注射 KYA1797K(25 mg/kg)减少了 70% 的肿瘤肿瘤和体积。KYA1797K 的处理显著地降低了 β -catenin 和 Ras 蛋白的水平，以及 Wnt/ β -catenin 和 Ras signaling 的下游靶标。在 KYA1797K 处理过的小鼠中，肝脏的重量没有发生改变，也没有异常。KYA1797K 显著降低了肿瘤细胞中核内 β -catenin 的水平以及膜上 Ras 蛋白。因此，KYA1797K 具有抗肿瘤效果。

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)

MB4050	<u>IWR-1-endo</u>
MB4598	<u>FH535</u>
MB4116	<u>IQ-1</u>

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。KYA1797K 是有效，选择性的 Wnt/ β -catenin 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

	1 mg	5 mg	10 mg
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
50 mM	0.0452 mL	0.2260 mL	0.4520 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: CRC 细胞系 : SW480, LoVo, DLD1 和 HCT15 细胞.</p> <p>Concentrations: 25 μM</p> <p>Incubation Time: 72 h</p> <p>Method:</p> <p>为了检测细胞增殖,将 HCT15 或 SW480 细胞以 2×10^4 个细胞/孔的密度铺于细胞培养板, D-WT 或 D-MT 细胞以 1×10^4 个细胞/孔的密度接种在 24 孔板。然后用 25 μM KYA1797K 或 DMSO 处理这些细胞 72 小时;在 96 孔板中,细胞接种密度为 3×10^3 个/孔。24 小时后,用 KY1220, KYA1797K, IWR-1 或 XAV939 处理细胞 4 天。向每孔加入 0.25 mg/ml 的 MTT 溶液, 37°C 孵育 2 小时后, 移除培养基获得不溶的紫色甲瓨, 并将它们置于 1 ml (24 孔) 或 200 μL (96 孔) 的 DMSO 中 1 小时。每 24 小时测定其在 590 nm 处的吸光值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 具有异种移植瘤的小鼠</p> <p>Formulation: 90% PBS 和 10% Tween 80</p> <p>Dosages: 25 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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。