

## ICG-001

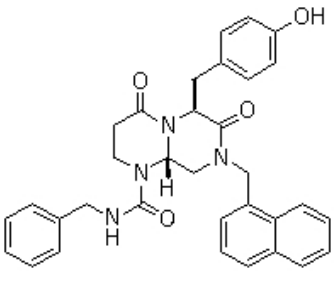
产品编号：MB4594

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C33H32N4O4	结 构 式	
分子量	548.63		
CAS No.	847591-62-2		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO：100 mg/mL (182.27 mM)		
	Water：Insoluble		
	Ethanol：10 mg/mL (18.22 mM)		
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：** ICG-001 拮抗 Wnt/ $\beta$ -catenin/TCF 介导的转录，并特异性结合到启动子结合蛋白 (CBP)。

### 别名：

(6S,9aS)-6-(4-hydroxybenzyl)-N-benzyl-8-(naphthalen-1-ylmethyl)-4,7-dioxo-hexahydro-2H-pyrazino[1,2-a]pyrimidine-1(6H)-carboxamide

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：100 mg/mL (182.27 mM)；Water：Insoluble；Ethanol：10 mg/mL (18.22 mM)

含量：.....>98%

**储存条件：** -20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	ICG-001 拮抗 Wnt/ $\beta$ -catenin/TCF 介导的转录，并特异性结合到启动子结合蛋白 (CBP)，IC50 为 3 $\mu$ M，但不能结合到相关的转录共激活因子 p300 上。
<b>靶点</b>	CBP (Cell-free assay) 3 $\mu$ M
<b>体外研究</b>	ICG-001 作用于 TOPFLASH 时，IC50 为 3 $\mu$ M，而对含突变 TCF 位点的相关报告基因结构，FOPFLASH 没有作用效果。使用 25 $\mu$ M ICG-001 处理 SW480 细胞 8 小时后，降低 Survivin 和 Cyclin D1 RNA 和蛋白的稳定水平，这两者都可通过 $\beta$ -catenin 上调。ICG-001 作用于转化细胞而不是正常结肠细胞，选择性诱导凋亡，降低结肠癌细胞生长。ICG-001 作用于 presenilin-1 突变细胞，可表型营救正常神经生长因子(NGF)诱导的神经元分化和神经轴突生长，强调 TCF/ $\beta$ -catenin 信号通路在神经轴突生长和神经元分化中的重要性。最新研究显示 5 $\mu$ M ICG-001 作用于 MCF7 细胞，抑制 leptin 诱导的 EMT，入侵和肿瘤干细胞球形成。
<b>体内研究</b>	ICG-001 水溶性类似物处理 9 周，降低 42%结肠和小肠息肉的形成，和非甾体类抗炎试剂 Sulindac 效果类似，Sulindac 是一贯治疗这种疾病模型的药物。在整个的处理期间观察不到明显的毒性。类似物按 150 mg/kg 剂量静脉注射处理 SW620 裸鼠肿瘤衰退移植瘤模型，处理 19 天，显著降低肿瘤体积，没有死亡，体重也没有降低。ICG-001 每天按 5 mg/kg 剂量处理小鼠，显著抑制 beta-catenin 信号，且降低 Bleomycin 诱导的肺纤维化，同时保护上皮细胞。

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)

MB4593	KYA1797K
MB4592	LGK-974

**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。ICG-001 拮抗 Wnt/ $\beta$ -catenin/TCF 介导的转录，并特异性结合到启动子结合蛋白 (CBP)，本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

浓 度	体 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8227 mL	9.1136 mL	18.2272 mL
5 mM	0.3645 mL	1.8227 mL	3.6454 mL
10 mM	0.1823 mL	0.9114 mL	1.8227 mL
50 mM	0.0365 mL	0.1823 mL	0.3645 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<p><b>激酶实验</b></p>	<p><b>双重-荧光素酶报告基因实验:</b> 双重-荧光素酶报告基因实验系统提供形成双重报告基因实验的有效方法。在 DLR™ 实验中, 顺序测量萤火虫型和花虫型荧光素酶活性。加入荧光素酶实验试剂 II (LAR II), 获得“辉光型”发光信号, 测量萤火虫型荧光素酶报告基因。定量测量萤火虫荧光素酶后, 淬灭反应, 同时在相同试管中加入 Stop &amp; Glo® 试剂开始花虫型荧光素酶反应。通过花型荧光素酶, Stop &amp; Glo® 试剂也产生“光辉型”信号, 在测量过程中缓慢降解。在 DLR™ 实验系统中, 两种报告基因都使用亚原子(&lt;10-18) 敏感性进行线性分析, 在实验宿主细胞中都没有内在活性。而且, DLR™ 实验的集成格式可以使在转化细胞或无细胞转录/翻译反应中快速测量报告基因。</p>
<p><b>细胞实验</b></p>	<p><b>Cell lines:</b> Human colon carcinoma cell lines SW480, SW620, and HCT116, normal colonic epithelial cell line CCD-841Co <b>Concentrations:</b> ~25 μM <b>Incubation Time:</b> 24 hours <b>Method:</b> 1. 在开始测定之前, 准备 Apo-ONE Caspase-3/7 试剂, 并充分混合。 2. 为获得最佳结果, 可能需要经验确定细胞培养系统的最佳细胞数, 凋亡诱导处理和培养期。 3. 对于测定和阴性对照样品使用相同的细胞数量和体积。 4. 不要通过手动移液混合 Apo-ONE Caspase-3/7 试剂和样品。以这种方式混合是不必要的, 并且可能产生干扰荧光读数或交叉污染样品的气泡。可以使用平板振荡器进行温和混合。 5. 测定的总孵育时间取决于样品中存在的半胱天冬酶-3/7 的量。 6. Apo-ONE Caspase-3/7 试剂配方用于介导细胞裂解并支持最佳 caspase-3/7 活性。在极少数情况下, 该试剂不会影响培养细胞的完全裂解。在这种情况下, 通过冻融循环增强裂解。为获得最佳效果, 在-70°C 冷冻, 然后在室温下解冻。平衡后, 混合均匀并孵育直至达到可测量的荧光。</p>
<p><b>动物实验</b></p>	<p><b>Animal Models:</b> 7 周大的雄性 C57BL/6J-Apc<sup>Min/+</sup> 小鼠 <b>Formulation:</b> 使用 ICG-001 水溶性类似物 <b>Dosages:</b> 300 mg/kg <b>Administration:</b> ICG-001 水溶性类似物每天口服处理, 持续 9 周</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。