

C646

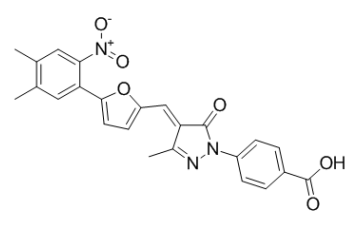
产品编号：MB5003

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG；50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C24H19N3O6	结 构 式	
分子量	445.42		
CAS No.	328968-36-1		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 13 mg/mL (29.19 mM) Water: Insoluble Alcohol: 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：C646 是选择性，竞争性的 histone acetyltransferase p300 抑制剂。

别名：Benzoic acid, 4-[4-[[5-(4,5-dimethyl-2-nitrophenyl)-2-furanyl]methylene]-4,5-dihydro-3-methyl-5-oxo-1H-pyrazol-1-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....棕色至酒红色固体

溶解性：.....DMSO 13 mg/mL (29.19 mM)；Water Insoluble；Alcohol 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	C646 是一种 histone acetyltransferase 抑制剂，抑制 p300，无细胞试验中 K_i 为 400 nM，相比于其它乙酰转移酶，优先作用于 p300。
特性	Extensively used as a pharmacologic probe in cancer cells. Potential use for prostate and lung cancers.
靶点	p300/CBP

	(Cell-free assay)
	400 nM(Ki)
体外研究	C646 是一种组蛋白乙酰转移酶抑制剂，抑制 p300，K _i 为 400 nM，选择性作用于其他乙酰转移酶。10 μM C646 在体外抑制 86% p300。C646 是传统的，可逆 p300 抑制剂。C646(25μM)作用于细胞，降低组蛋白 H3 和 H4 乙酰化水平，且废除 TSA 诱导的乙酰化。C646(20μM)作用于对雄激素敏感的阉割性前列腺癌细胞系，通过干扰 AR 和 NF-κB 通路，而诱导细胞凋亡。C646 作用于小鼠细胞，抑制全部 H3K4me3 动态乙酰化，且局部横跨启动子和诱导基因的起始位点，从而干扰 RNA 聚合酶 II 相互作用和这些基因的激活。
体内研究	弱灭绝训练后，C646 立即注入到 ILPFC，增强恐惧消退记忆的整合。C646 处理脊髓，衰减机械痛和热痛觉过敏，伴随着抑制 COX-2 表达。

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。C646 是选择性，竞争性的 histone acetyltransferase p300 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置：

体 DMSO 质量 浓度 积 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2451 mL	11.2254 mL	22.4507 mL
5 mM	0.4490 mL	2.2451 mL	4.4901 mL
10 mM	0.2245 mL	1.1225 mL	2.2451 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）

激酶实验	<p>放射性检测：</p> <p>使用直接放射性测定法测定对假定的 p300 HAT 抑制剂的 IC₅₀ 值。反应在 20 mM HEPES (pH 7.9) 中进行，包含 5 mM DTT, 80μM EDTA, 40μg/ml BSA, 100μM H4-15, 和 5 nM p300。加入在一个浓度范围内的假定抑制剂，DMSO 浓度保持不变(<5%)。反应在 30°C 下温育 10 分钟，然后加入 1:1 ¹²C-acetyl-CoA 和 ¹⁴C-acetyl-CoA 的混合物到 20 mM，开始反应。在 30°C 下进行 10 分钟后，使用 14% SDS (w/v) 淬灭。所有浓度按一式两份筛选。跑胶，洗涤，干燥，暴露于 PhosphorImager 板上，对产生的 Ac-H4-15 进行量化，得到 IC₅₀ 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: C3H10T1/2</p> <p>Concentrations: ~25 μM</p> <p>Incubation Time: 1 到 3 小时</p> <p>Method: 在小鼠细胞中测定组蛋白乙酰化。C3H10T1/2 小鼠成纤维细胞在含 10% FCS 的 DMEM 培养基中在 37°C 下含 6% CO₂ 的环境中生长。铺满培养物在含 0.5% FCS 的</p>

	DMEM 培养基中静置 18-20 小时，然后再处理。使用如下化合物处理细胞：TSA (10 ng/ml [33 nM]), C646 (25 μM), C37 (25 μM)。使用如下浓度的抗体: 总 H3 (1:10000); H4K12ac (1:2500)。兔 anti-H3K9ac(1:10000)抗体内部产生。通过酸提取从细胞中分离组蛋白，经 SDS 和酸-尿素聚丙烯酰胺凝胶电泳分离，并通过免疫印迹分析。
动物实验	Animal Models: 小鼠 Formulation: 10% DMSO Dosages: 每种情况下 2×0.75 μl 注射体积, 1.5 μg, 处理 超过 2 分钟 Administration: 注入 ILPFC

【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。