

## XAV939 ; XAV-939 ; NVP-XAV 939

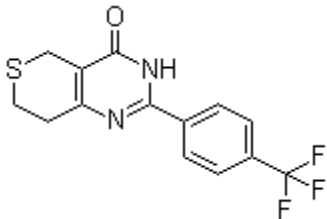
产品编号 : MB6671

质量标准 : >98%

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C14H11F3N2OS	结 构 式	
分子量	312.31		
CAS No.	284028-89-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 12 mg/mL (38.42 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 :** XAV-939 是端锚聚合酶 tankyrase (TNKS)抑制剂, 也是间接的 Wnt/ $\beta$ -catenin signaling 抑制剂。

**别名 :** 4H-Thiopyrano[4,3-d]pyrimidin-4-one, 3,5,7,8-tetrahydro-2-[4-(trifluoromethyl)phenyl]-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 12 mg/mL (38.42 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>	XAV-939 通过抑制 tankyrase1/2 而选择性抑制 Wnt/ $\beta$ -catenin 介导的转录, 无细胞试验中 IC50 为 11 nM/4 nM, 调节轴蛋白水平, 而对 CRE, NF- $\kappa$ B 和 TGF- $\beta$ 无作用。	
<b>靶点</b>	TNKS2 (Cell-free assay)	TNKS1 (Cell-free assay)
	4 nM	11 nM

<b>体外研究</b>	<p>XAV939 是小分子选择性抑制剂，抑制 Wnt 通路转录因子 <math>\beta</math>-catenin 调节的转录，作用于 TNKS1 和 TNKS2 时 IC50 分别为 11 和 4nM。XAV939 通过稳定 axin 和断裂混合物的极限浓度组成促进 <math>\beta</math>-catenin 降解，而稳定 axin 是通过阻断 PAR 酶：端锚聚合酶 1 和 2。2 种端锚聚合酶亚型因为 axin 的高度保守区而相互作用，促进了端锚聚合酶通过泛素-蛋白酶体途径的降解。XAV939 抑制 Wnt/<math>\beta</math>-catenin 通路活性已经用于多种癌症治疗。XAV939 尤其抑制端锚聚合酶 PARP 活性。XAV939 明显降低 DNA-PKcs 蛋白水平，说明了在维持 DNA-PKcs 蛋白稳定性时端锚聚合酶 PARP 活性的关键性。用 1.0 <math>\mu</math>M XAV939 处理 12 小时，DNA-PKcs 蛋白水平降低到最低水平，与用 DMSO 处理的对照组相比，相对表达量小于 25%。1.0 <math>\mu</math>M XAV939 治疗人类成淋巴细胞，导致端锚聚合酶 1 水平明显上升。</p>
-------------	--

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)

MB4053	KY02111
MB4597	Wnt Agonist 1
MB4051	Wnt-C59 (C59)

**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。XAV-939 通过抑制 tankyrase1/2 而选择性抑制 Wnt/ $\beta$ -catenin 介导的转录，本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2019 mL	16.0097 mL	32.0195 mL
5 mM	0.6404 mL	3.2019 mL	6.4039 mL
10 mM	0.3202 mL	1.6010 mL	3.2019 mL
50 mM	-	-	-

#### 经典实验操作（仅供参考）

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> WTK1 成淋巴细胞 <b>Concentrations:</b> 1.0 <math>\mu</math>M <b>Incubation Time:</b> 8 小时 <b>Method:</b> XAV939 溶解在 DMSO 中，储存浓度为 10mM，实验处理时稀释到 100 <math>\mu</math>M。实验组，用 1.0 <math>\mu</math>M XAV939 处理 WTK1 成淋巴细胞 8 小时，对照组用 DMSO 处理，上样到 4-20%梯度 SDS-PAGE 孔中。2 小时上样一次。在 0, 2, 和 4 小时分别上样，结果分别跑胶 2, 4, 和 6 小时。最后，通过 western blot 分析。</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。