

C646

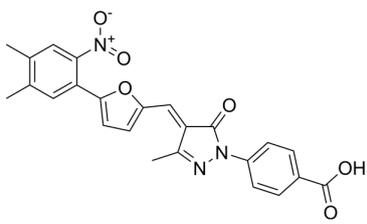
产品编号: MC8007

质量标准: >98%, BR

包装规格: 5mg / 10mg / 50mg / 100mg

产品形式: 固体

基本信息:

分子式	C ₂₄ H ₁₉ N ₃ O ₆	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		
运输条件	湿冰运输 (按季节)		

简介: C646 是一种组蛋白乙酰转移酶 p300 的抑制剂 (K_i=400 nM), 具有竞争性和选择性, 对其他乙酰转移酶作用较小。C646 具有细胞凋亡诱导剂和放射增敏剂的作用。

别名: C 646

物理性状及指标:

外观:棕色或红棕色固体

溶解性:DMSO: 11mg/mL

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>98%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。C646 已被证明具有多效性, 包括神经保护、抗癌和抗上皮间质转化(anti-EMT)作用。

生物活性:

靶点	CBP/p300
体外研究	<p>C646 是 p300 与乙酰辅酶 A 的线性竞争性抑制剂, K_i 为 400nM。C646 显示 p300 抑制与 H4-15 肽底物的非竞争性模式。C646 处理可降低组蛋白 H3 和 H4 乙酰化水平并消除细胞中 TSA 诱导的乙酰化。C646 对细胞生长的影响比 Lys-CoA-Tat 更有效^[1]。</p> <p>C646 增强 IR 后的有丝分裂灾难, 抑制 IRin A549 细胞后 CHK1 的磷酸化^[2]。</p> <p>C646 减弱 GATA1 乙酰化增加和 EDAG 诱导的 GATA1 转录活性增加^[3]。</p>

溶液配制:

制备储备液	溶剂体积 / 质量		1mg	5mg	10mg
	浓度				
	1mM		2.2451 mL	11.2254 mL	22.4507 mL
	5mM		0.4490 mL	2.2451 mL	4.4901 mL
	10mM		0.2245 mL	1.1225 mL	2.2451 mL



使用方法：（仅供参考）

激酶试验	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 20mM HEPES (pH 7.9) 中进行，包含 5mM DTT, 80μM EDTA, 40μg/mL BSA, 100μM H4-15 和 5nM 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 20mM，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。
细胞试验	Cell lines: SH-SY5Y 细胞 Concentrations: ~25μM Incubation Time: 1~3 小时 Method: 小鼠成纤维细胞 SH-SY5Y 用 C646 (25 μM) 处理 1-3 h，加入 TSA (33 nM) 进行最后 30 min 的孵育，使用 Western Blot 检测靶点蛋白表达水平。
动物实验	Animal Models: C57BL/6J 成年小鼠 Formulation: 生理盐水 Dosages: 5~10mg/kg，每天一次，持续十天。 Administration: 腹腔注射

【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（如 0.22μm 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

- [1]. Bowers EM, et al. Virtual ligand screening of the p300/CBP histone acetyltransferase: identification of a selective small molecule inhibitor. Chem Biol. 2010 May 28;17(5):471-82.
- [2]. Oike T, et al. C646, a selective small molecule inhibitor of histone acetyltransferase p300, radiosensitizes lung cancer cells by enhancing mitotic catastrophe. Radiother Oncol. 2014 May;111(2):222-7.
- [3]. Zheng WW, et al. EDAG positively regulates erythroid differentiation and modifies GATA1 acetylation through recruiting p300. Stem Cells. 2014 Aug;32(8):2278-89.

S241001

