

C646

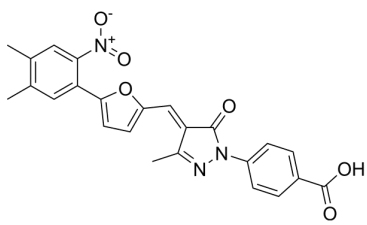
产品编号: MC8007

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

