

产品名称：(E)-3-(对甲苯磺酰基)丙烯腈

英文名：BAY 11-7082

生物活性:				
Description	BAY 11-7082 is an IκBα phosphorylation and NF-κB inhibitor. BAY 11-7082 selectively and irreversibly inhibits the TNF-α-induced phosphorylation of IκB-α, and decreases NF-κB and expression of adhesion molecules. BAY 11-7082 inhibits ubiquitin-specific protease USP7 and USP21 (IC50=0.19, 0.96 μM, respectively). BAY 11-7082 inhibits gasdermin D (GSDMD) pore formation in liposomes and inflammasome-mediated pyroptosis and IL-1β secretion in human and mouse cells[1].			
IC50 & Target	NF-κB	USP7	USP21	Autophagy
		0.19 μM (IC50)	0.96 μM (IC50)	
In Vitro	BAY 11-7082 (BAY 11-7821) 是一种 NF-κB 抑制剂,可诱导 HTLV-I 感染的 T 细胞系凋亡,但仅可忽略 HTLV-I 阴性 T 细胞的凋亡。Bay 11-7082 快速有效地降低 HTLV-I 感染的 T 细胞系中 NF-κB 的 DNA 结合,并下调受 NF-κB 调节的抗凋亡基因 Bcl-xL 的表达。Bay 11-7082 选择性抑制人 T 细胞系中 Tax 诱导的 NF-κB 活性[1]。 BAY 11-7082 可抑制 NFκB 信号传导,最近显示可通过与催化性半胱氨酸残基共价反应来抑制大多数 E2 和 E3 连接酶。此外,BAY 11-7082 还通过与这些酶的催化性 Cys 残基反应来抑制几种酪氨酸磷酸酶。NSC 697923 最初显示可抑制 E2 连接酶 Ubc13-Uev1A[2]。 BAY 11-7082 抑制 IκBα 的磷酸化和 NF-κB 的激活,诱导 HBL-1 细胞死亡。BAY 11-7082 完全抑制 IKKβ 激活环的 LPS 刺激和 IL-1 刺激磷酸化[3]。 BAY 11-7082 通过抑制 TNF-α 诱导的 IκB-α 磷酸化,导致 NF-κB 减少和粘附分子表达减少[4]。.			
In Vivo	BAY 11-7082 (2.5 mg/kg 和 5 mg/kg; 瘤内注射; 每周两次,持续 21 天) 以剂量依赖性方式显著抑制肿瘤生长[6].			
	Animal Model:	Four-week-old male BALB/c nude mice with human gastric carcinoma cell lines HGC-27 ^[6]		
	Dosage:	Low-dose (2.5 mg/kg body weight), high-dose (5 mg/kg body weight)		
	Administration:	Intratumoral injection; twice-weekly for 21 days		
	Result:	Suppressed tumor growth in a dose-dependent manner.		
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (482.51 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响,请使用新开封的 DMSO)			
	* "≥" means soluble, but saturation unknown.			
	完整储备液配制表见最后			
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液;一旦配成溶液,请分装保存,避免反复冻融造成的产品失效。			
Solvent&Solubility	储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时,请在 6 个月内使用, -20°C 储存时,请在 1 个月内使用。			
	动物实验:			
	以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液,再依次添加助溶剂:			
	——为保证实验结果的可靠性,澄清的储备液可以根据储存条件,适当保存;体内实验的工作液,建议您现用现配,当天使用;			
	以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比;如在配制过程中出现沉淀、析出现象,可以通过加热和/或超声的方式助溶			

	方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO 40% PEG300 $\Rightarrow$ 5% Tween-80 $\Rightarrow$ 5% Saline $\Rightarrow$ Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (12.06 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO 90% Corn oil $\Rightarrow$ Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (12.06 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。																																																									
References	[1]. Mori N, et al. Bay 11-7082 inhibits transcription factor NF-kappaB and induces apoptosis of HTLV-I-infected T-cell lines and primary adult T-cell leukemia cells. Blood. 2002 Sep 1;100(5):1828-1834. [Content Brief] [2]. Ritorto MS, et al. Screening of DUB activity and specificity by MALDI-TOF mass spectrometry. Nat Commun. 2014 Aug 27;5:4763. [Content Brief] [3]. Strickson S, et al. The anti-inflammatory drug BAY 11-7082 suppresses the MyD88-dependent signalling network by targeting the ubiquitin system. Biochem J. 2013 May 1;451(3):427-437. [Content Brief] [4]. Pierce JW, et al. Novel inhibitors of cytokine-induced IkappaBalpha phosphorylation and endothelial cell adhesion molecule expression show anti-inflammatory effects in vivo. J Biol Chem. 1997 Aug 22;272(34):21096-103. [Content Brief] [5]. Jun Jacob Hu, et al. Identification of pyroptosis inhibitors that target a reactive cysteine in gasdermin D. The Preprint Server For Biology, 2018,Jul. 10. [6]. Chen L , et al. BAY 11-7082, a nuclear factor-kB inhibitor, induces apoptosis and S phase arrest in gastric cancer cells. J Gastroenterol. 2014 May;49(5):864-74. [Content Brief]																																																									
完整储备液配制表：																																																										
	<table><tr><th>可选溶剂</th><th>浓度溶剂体积质量</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th><th>25 mg</th></tr><tr><td rowspan="10">DMSO</td><td>1 mM</td><td>4.8251 mL</td><td>24.1255 mL</td><td>48.2509 mL</td><td>120.6273 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.9650 mL</td><td>4.8251 mL</td><td>9.6502 mL</td><td>24.1255 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.4825 mL</td><td>2.4125 mL</td><td>4.8251 mL</td><td>12.0627 mL</td></tr><tr><td>15 mM</td><td>0.3217 mL</td><td>1.6084 mL</td><td>3.2167 mL</td><td>8.0418 mL</td></tr><tr><td>20 mM</td><td>0.2413 mL</td><td>1.2063 mL</td><td>2.4125 mL</td><td>6.0314 mL</td></tr><tr><td>25 mM</td><td>0.1930 mL</td><td>0.9650 mL</td><td>1.9300 mL</td><td>4.8251 mL</td></tr><tr><td>30 mM</td><td>0.1608 mL</td><td>0.8042 mL</td><td>1.6084 mL</td><td>4.0209 mL</td></tr><tr><td>40 mM</td><td>0.1206 mL</td><td>0.6031 mL</td><td>1.2063 mL</td><td>3.0157 mL</td></tr><tr><td>50 mM</td><td>0.0965 mL</td><td>0.4825 mL</td><td>0.9650 mL</td><td>2.4125 mL</td></tr><tr><td>60 mM</td><td>0.0804 mL</td><td>0.4021 mL</td><td>0.8042 mL</td><td>2.0105 mL</td></tr></table>	可选溶剂	浓度溶剂体积质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	DMSO	1 mM	4.8251 mL	24.1255 mL	48.2509 mL	120.6273 mL	5 mM	0.9650 mL	4.8251 mL	9.6502 mL	24.1255 mL	10 mM	0.4825 mL	2.4125 mL	4.8251 mL	12.0627 mL	15 mM	0.3217 mL	1.6084 mL	3.2167 mL	8.0418 mL	20 mM	0.2413 mL	1.2063 mL	2.4125 mL	6.0314 mL	25 mM	0.1930 mL	0.9650 mL	1.9300 mL	4.8251 mL	30 mM	0.1608 mL	0.8042 mL	1.6084 mL	4.0209 mL	40 mM	0.1206 mL	0.6031 mL	1.2063 mL	3.0157 mL	50 mM	0.0965 mL	0.4825 mL	0.9650 mL	2.4125 mL	60 mM	0.0804 mL	0.4021 mL	0.8042 mL	2.0105 mL
可选溶剂	浓度溶剂体积质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg																																																					
DMSO	1 mM	4.8251 mL	24.1255 mL	48.2509 mL	120.6273 mL																																																					
	5 mM	0.9650 mL	4.8251 mL	9.6502 mL	24.1255 mL																																																					
	10 mM	0.4825 mL	2.4125 mL	4.8251 mL	12.0627 mL																																																					
	15 mM	0.3217 mL	1.6084 mL	3.2167 mL	8.0418 mL																																																					
	20 mM	0.2413 mL	1.2063 mL	2.4125 mL	6.0314 mL																																																					
	25 mM	0.1930 mL	0.9650 mL	1.9300 mL	4.8251 mL																																																					
	30 mM	0.1608 mL	0.8042 mL	1.6084 mL	4.0209 mL																																																					
	40 mM	0.1206 mL	0.6031 mL	1.2063 mL	3.0157 mL																																																					
	50 mM	0.0965 mL	0.4825 mL	0.9650 mL	2.4125 mL																																																					
	60 mM	0.0804 mL	0.4021 mL	0.8042 mL	2.0105 mL																																																					

	80 mM	0.0603 mL	0.3016 mL	0.6031 mL	1.5078 mL
	100 mM	0.0483 mL	0.2413 mL	0.4825 mL	1.2063 mL