



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **K858**
CAS 号: **72926-24-0**
产品货号: **S86342**

生物活性:				
Description	K858 Racemic 是一种 ATP 非竞争性的驱动蛋白 Eg5 抑制剂, IC50 值为 1.3 μ M。			
IC50 & Target[1]	Eg5 1.3 μ M (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HCT-116	IC50	1.3 μ M	Inhibition of Eg5 in human HCT116 cells assessed as inhibition of microtubule-induced ATPase activity after 18 hrs
In Vitro	K858 (Racemic) 是一种 ATP 非竞争性 Eg5 抑制剂, IC50 值为 1.3 μ M。即使在 200 μ M, K858 (Racemic) 也不会抑制有丝分裂驱动蛋白 CENP-E 和 MKLP1 或常规驱动蛋白重链的 ATPase 活性。K858 (Racemic) 通过激活 Mad2 介导的纺锤体检查点诱导有丝分裂停滞和生长抑制。K858 (Racemic) (5 μ M) 在癌细胞而非正常细胞中诱导有丝分裂细胞死亡[1]。K858 (Racemic) (1、10、100 μ M) 抑制 MCF7、BT474 和 SKBR3 细胞系, 处理 24 小时后仅在 10 和 100 μ M 时抑制 MDA-MB231 细胞系。K858 (Racemic) 增加四种细胞系中的 Bax/Bcl2 RNA 比率 and 生存素。此外, 生存素的上调在 MCF7 细胞中被缬氨霉素 (磷酸肌醇 3-激酶 AKT) 完全逆转[2]。			
In Vivo	K858 (Racemic) (50, 150 mg/kg, 口服) 在 A2780 卵巢癌异种移植模型中表现出抗肿瘤活性, 在 HCT116 结肠癌异种移植模型中通过 100 mg/kg 口服, 每天两次, 持续 5 天也抑制肿瘤生长。K858 (Racemic) (100 mg/kg, 口服, qd $\times$ 5) 在小鼠体内没有神经毒性副作用[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (360.56 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
		1 mM	3.6056 mL	18.0278 mL
		5 mM	0.7211 mL	3.6056 mL
		10 mM	0.3606 mL	1.8028 mL
	*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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 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 $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline			



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.01 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.01 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。
参考文献	[1]. Nakai R, et al. K858, a novel inhibitor of mitotic kinesin Eg5 and antitumor agent, induces cell death in cancer cells. Cancer Res. 2009 May 1;69(9):3901-9. [2]. De Iuliis F, et al. The kinesin Eg5 inhibitor K858 induces apoptosis but also survivin-related chemoresistance in breast cancer cells. Invest New Drugs. 2016 Aug;34(4):399-406.

完整储备液配制表:

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。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.6056 mL	18.0278 mL	36.0557 mL	90.1391 mL
	5 mM	0.7211 mL	3.6056 mL	7.2111 mL	18.0278 mL
	10 mM	0.3606 mL	1.8028 mL	3.6056 mL	9.0139 mL
	15 mM	0.2404 mL	1.2019 mL	2.4037 mL	6.0093 mL
	20 mM	0.1803 mL	0.9014 mL	1.8028 mL	4.5070 mL
	25 mM	0.1442 mL	0.7211 mL	1.4422 mL	3.6056 mL
	30 mM	0.1202 mL	0.6009 mL	1.2019 mL	3.0046 mL
	40 mM	0.0901 mL	0.4507 mL	0.9014 mL	2.2535 mL
	50 mM	0.0721 mL	0.3606 mL	0.7211 mL	1.8028 mL
	60 mM	0.0601 mL	0.3005 mL	0.6009 mL	1.5023 mL
	80 mM	0.0451 mL	0.2253 mL	0.4507 mL	1.1267 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0361 mL	0.1803 mL	0.3606 mL	0.9014 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶