



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: T-1101 tosylate

CAS 号: 2250404-95-4

产品货号: S87648

生物活性:

Description	T-1101 tosylate (TAI-95 tosylate) 是 T-1101 (HY-120356) 的甲磺酸盐形式。T-1101 tosylate 是口服有效的抑制剂, 可以抑制调节有丝分裂的高表达癌蛋白 1 (Hec1)。T-1101 tosylate 可阻断 Hec1 和 NEK2 之间的相互作用, 在人肝癌细胞中表现出细胞毒性, GI50 为 15-70 nM。T-1101 tosylate 可诱导 Huh-7 细胞凋亡 (apoptosis)。T-1101 tosylate 在小鼠模型中表现出抗肿瘤活性。			
IC50 & Target	NEK2			
In Vitro	T-1101 tosylate shows potent in vitro antiproliferative activity (IC50: 14.8-21.5 nM)[2].			
	T-1101 tosylate disrupts the Hec1/Nek2 protein - protein interaction in the cells[2].			
	T-1101 tosylate (1 μ M; 3-24 24 hours) decreases the level of Nek2 in a time-dependent manner[2].			
	T-1101 tosylate (1 μ M; 24 hours) induces apoptosis[2].			
	T-1101 tosylate reduces amounts of cell-cycle related proteins cyclin A1, cyclin B1, and cyclin D1[2].			
	Apoptosis Analysis[2]			
	Cell Line:	HeLa cells		
	Concentration:	1 μM		
	Incubation Time:	24 hours		
	Result:	Increased the amount of apoptotic marker proteins cleaved caspase-3 and PARP and decreased the amount of antiapoptotic proteins Mcl-1 and XIAP in HeLa cells.		
In Vivo	Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:	K562 cells		
	Concentration:	1 μM		
	Incubation Time:	3 hours, 6 hours, 16 hours, 24 hours		
	Result:	Lowered the level of Nek2 in a time-dependent manner.		
	T-1101 tosylate shows good oral bioavailability and thermal stability [2].			
	Oral co-administration of T-1101 tosylate (2.5 mg/kg; p.o.; twice per day) halves the dose of sorafenib (25 mg/kg to 12.5 mg/kg) required to exhibit comparable in vivo activity towards Huh-7 xenografts [2].			
	T-1101 tosylate (2.5 mg/kg; p.o.; twice per day) shows significant in vivo activity in mice bearing various human cancer xenografts[2].			
	Animal Model:	SCID mice bearing human Huh-7, BT-474, MCF-7, and MDA-MB-231 xenografts[2]		
	Dosage:	25 mg/kg, 50 mg/kg		
Administration:	Oral administration; twice per day; 28 days			
Result:	Showed significant in vivo activity in mice bearing various human cancer xenografts.			
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : 62.5 mg/mL (93.87 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	SolventMassConcentration 1 mM	1 mg1.5020 mL	5 mg7.5098 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: shyyssw@sina.com

	Stock Solutions	5 mM	0.3004 mL	1.5020 mL	3.0039 mL
		10 mM	0.1502 mL	0.7510 mL	1.5020 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-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： 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.12 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。					
参考文献	[1]. Huang LY, et al., Inhibition of Hec1 as a novel approach for treatment of primary liver cancer. Cancer Chemother Pharmacol. 2014 Sep;74(3):511-20. [2]. Chuang SH, et al. Discovery of T-1101 tosylate as a first-in-class clinical candidate for Hec1/Nek2 inhibition in cancer therapy. Eur J Med Chem. 2020 Apr 1;191:112118.				

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, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	1 mM	1.5020 mL	7.5098 mL	15.0195 mL	37.5488 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: shyyssw@sina.com

DMSO	5 mM	0.3004 mL	1.5020 mL	3.0039 mL	7.5098 mL
	10 mM	0.1502 mL	0.7510 mL	1.5020 mL	3.7549 mL
	15 mM	0.1001 mL	0.5007 mL	1.0013 mL	2.5033 mL
	20 mM	0.0751 mL	0.3755 mL	0.7510 mL	1.8774 mL
	25 mM	0.0601 mL	0.3004 mL	0.6008 mL	1.5020 mL
	30 mM	0.0501 mL	0.2503 mL	0.5007 mL	1.2516 mL
	40 mM	0.0375 mL	0.1877 mL	0.3755 mL	0.9387 mL
	50 mM	0.0300 mL	0.1502 mL	0.3004 mL	0.7510 mL
	60 mM	0.0250 mL	0.1252 mL	0.2503 mL	0.6258 mL
	80 mM	0.0188 mL	0.0939 mL	0.1877 mL	0.4694 mL



源叶