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

产品名称：TFEB activator 1
CAS 号：39777-61-2
产品货号：S87652

生物活性：

Description

TFEB activator 1 是一种口服有效的，不依赖 mTOR 的 TFEB 激活剂。TFEB activator 1 显着促进 Flag-TFEB 的核易位，EC50 为 2167 nM。TFEB activator 1 在不抑制 mTOR 通路的情况下增强自噬 (autophagy)。TFEB activator 1 有潜力用于神经退行性疾病的研究。

IC50 & Target

EC50: 2167 nM (Flag-TFEB nuclear translocation)[1]

Cellular Effect

Cell Line	Type	Value	Description
HCT-116	GI_{50}	4 μM	Growth inhibition of human HCT116 cells after 48 hrs by MTS assay
HeLa	IC_{50}	161 μM	Cytotoxicity against human HeLa cells after 72 hrs by MTT assay
HL-60	IC_{50}	< 12.6 μM	Cytotoxicity against human HL60 cells after 72 hrs by MTT assay
KB	IC_{50}	< 12.6 μM	Cytotoxicity against human KB cells after 72 hrs by MTT assay
MDA-MB-231	GI_{50}	1 μM	Growth inhibition of human MDA-MB-231 cells measured after 72 hrs by microplate reader analysis
RPMI-7951	GI_{50}	2.3 μM	Growth inhibition of human RPMI-7951 cells measured after 72 hrs by microplate reader analysis

In Vitro

TFEB 激活剂 1 (化合物 C1) 通过直接结合 TFEB 激活 TFEB (转录因子 EB) 并促进其进入细胞核，而不影响 TFEB 磷酸化或抑制 MTOR 和 MAPK1/ERK2-MAPK3/ERK1 的活性[1]。

TFEB 激活剂 1 (1 μM；持续 12 小时) 显著增加 LC3B-II 的水平，LC3B-II 是脂化和吞噬细胞或自噬体相关形式的 MAP1LC3B/LC3B (微管相关蛋白 1 轻链 3 β) N2a 细胞[1]。

TFEB 激活剂 1 (0.2-1 μM) 以剂量依赖性方式增加 N2a 细胞中 LC3-II 和 SQSTM1/p62 (sequestosome 1) 的水平[1].

Western Blot Analysis[1]

Cell Line:	N2a cells
Concentration:	0, 0.2, 0.4, 0.6, 0.8 and 1 μM
Incubation Time:	12 hours
Result:	Treatment dose-dependently increased the levels of LC3-II and SQSTM1/p62 (sequestosome 1).

In Vivo

TFEB activator 1 (化合物 C1) 的中等致死剂量 (LD50) 在急性毒性试验 (单剂量，尾静脉注射；大鼠) 中为 175 mg/kg[1]。

短期口服 TFEB activator 1 (低剂量 10 mg/kg 和 高剂量 25 mg/kg；24 小时) 剂量依赖性增加肝脏、额叶皮质中 LC3B-II 和 TFEB 的表达和大脑纹状体[1]。

长期给予 TFEB activator 1 (每天 10 mg/kg；通过管饲法口服) 可激活 TFEB 并增强大鼠脑中的自噬[1]。

Animal Model:	Adult male Sprague-Dawley (SD) rats weighing 350 to 400 g[1]
Dosage:	10 mg/kg and 25 mg/kg
Administration:	Short-term oral administration; for 24 hours

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

Result:	Activated TFEB and enhanced autophagy and lysosome biogenesis in rat brain.
Animal Model:	Adult male Sprague-Dawley (SD) rats weighing 350 to 400 g[1]
Dosage:	10 mg/kg
Administration:	Chronic oral administration; daily; for 21 days
Result:	Activated TFEB and enhanced autophagy in rat brains.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：125 mg/mL (424.68 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 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	3.3974 mL	16.9872 mL	33.9743 mL
	5 mM	0.6795 mL	3.3974 mL	6.7949 mL
	10 mM	0.3397 mL	1.6987 mL	3.3974 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；该产品在溶液状态不稳定，建议您现用现配，即刻使用。

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 → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 6.25 mg/mL (21.23 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 6.25 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 62.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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： 50% PEG300 → 50% Saline

Solubility: 4 mg/mL (13.59 mM); 悬浊液; 超声助溶。

参考文献

[1]. Song JX, et al. A novel curcumin analog binds to and activates TFEB in vitro and in vivo independent of MTOR inhibition. Autophagy. 2016 Aug 2;12(8):1372-89.

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；该产品在溶液状态不稳定，建议您现用现配，即刻使用。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg

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

DMSO	**1 mM**	3.3974 mL	16.9872 mL	33.9743 mL	84.9358 mL
	5 mM	0.6795 mL	3.3974 mL	6.7949 mL	16.9872 mL
	10 mM	0.3397 mL	1.6987 mL	3.3974 mL	8.4936 mL
	15 mM	0.2265 mL	1.1325 mL	2.2650 mL	5.6624 mL
	20 mM	0.1699 mL	0.8494 mL	1.6987 mL	4.2468 mL
	25 mM	0.1359 mL	0.6795 mL	1.3590 mL	3.3974 mL
	30 mM	0.1132 mL	0.5662 mL	1.1325 mL	2.8312 mL
	40 mM	0.0849 mL	0.4247 mL	0.8494 mL	2.1234 mL
	50 mM	0.0679 mL	0.3397 mL	0.6795 mL	1.6987 mL
	60 mM	0.0566 mL	0.2831 mL	0.5662 mL	1.4156 mL
	80 mM	0.0425 mL	0.2123 mL	0.4247 mL	1.0617 mL
	100 mM	0.0340 mL	0.1699 mL	0.3397 mL	0.8494 mL