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：EB-3D

CAS 号：1839150-63-8

产品货号：S87653

生物活性：

Description	EB-3D 是有效的选择性胆碱激酶 α (ChoKα) 抑制剂，对 ChoKα1 的 IC50 值为 1 μM。EB-3D 对 ChoKα 表达、AMPK 激活、细胞凋亡 (apoptosis)、内质网应激和脂质代谢有影响。EB-3D 在一组 T-白血病细胞系中显示出强大的抗增殖活性。具有抗癌活性。
IC50 & Target	IC50: 1 μM; Kd: 0.7 μM[3]
In Vitro	EB-3D 显示 (0-100 μM；72 小时) 对广泛的 T 白血病细胞系具有出色的抗增殖活性，GI GI50s 13 值在纳摩尔范围内[1]。 EB-3D (1.25-5 μM；24 小时) 诱导白血病细胞系凋亡[1]。 EB-3D (0.5-1 μM；24 小时) 诱导导致细胞凋亡的 G0/G1 期阻滞[1]。 EB-3D (0.3 μM；48 小时) 在 30 分钟后显示 AMPKα 激活的第一个尖峰以及随后 T172[1] 的磷酸化增加。 EB-3D (1-40 μM；48 小时) 抑制 HepG2 细胞的细胞生长，GI50 14.55 μM[2]。 EB-3D 诱导 AMPK-mTOR 通路失调和白血病 T 细胞凋亡[1].

Cell Proliferation Assay[1]	
Cell Line:	JURKAT, CCRF-CEM, HSB-2, MOLT-16, DNA-41, LOUCY, PEER, ALL-SIL cells
Concentration:	0.001, 0.01, 0.1, 1, 10, 100 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Inhibited JURKAT, CCRF-CEM, HSB-2, MOLT-16, DNA-41, LOUCY, PEER, and ALL-SIL cells growth with GI_{50}s of 136.2, 478.8, 17.7, 0.9, 60.6, 200, 265, and 132 nM, respectively.
Apoptosis Analysis[1]	
Cell Line:	Jurkat, CCRF-CEM and HSB-2 cells
Concentration:	1.25, 2.5, 5 μM
Incubation Time:	24 hours
Result:	Induced apoptosis in leukemia cell lines.
Cell Cycle Analysis[1]	
Cell Line:	Jurkat, CCRF-CEM and HSB-2 cells
Concentration:	0.5, 1 μM
Incubation Time:	24 hours
Result:	Induces cell cycle arrest in G0/G1 phase.
Western Blot Analysis[1]	
Cell Line:	Jurkat cells
Concentration:	0.3 μM
Incubation Time:	48 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: Showed a first spike of activation of AMPKα after 30 minutes of treatment and a later increase in the phosphorylation of T172. The increase in S79 phosphorylation of its main target ACC (acetyl-coenzyme A (CoA) carboxylase), followed the same pattern. This rapid activation of AMPK, in turn induced a consequent reduction in mTOR phosphorylation that is visible already at 30' and that becomes amplified at longer time probably due to the interruption of feedback loops that are characteristic of mTOR connecting pathways.
In Vivo	EB-3D (1 mg/kg；腹腔注射；每隔一天) 在同源原位 E0771-C57BL/6 小鼠模型中抑制乳腺肿瘤的生长[4]。 EB-3D (2.5 mg /kg；每隔一天，持续 4 周) 显示自发性肺大转移和微转移的数量减少[4]。 **Animal Model:** E0771-C57BL/6 mice[4] **Dosage:** I.p.; every other day for 4 weeks **Administration:** 2.5 mg/kg **Result:** A reduction of the number of spontaneous lung macro- and micrometastasis.
Solvent&Solubility	**细胞实验:** DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (77.59 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) H2O 中的溶解度 : ≥ 9.09 mg/mL (14.11 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.5517 mL	7.7587 mL	15.5173 mL
	5 mM	0.3103 mL	1.5517 mL	3.1035 mL
	10 mM	0.1552 mL	0.7759 mL	1.5517 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。
* 备注：如您选择水作为储备液，请稀释至工作液后，再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。

参考文献

[1]. Mariotto E, et al. EB-3D a novel choline kinase inhibitor induces deregulation of the AMPK-mTOR pathway and apoptosis in leukemia T-cells. Biochem Pharmacol. 2018 Sep;155:213-223.
[2]. Sola-Leyva A, et al. Choline kinase inhibitors EB-3D and EB-3P interferes with lipid homeostasis in HepG2 cells. Sci Rep. 2019 Mar 25;9(1):5109.
[3]. Schiaffino-Ortega S, et al. Design, synthesis, crystallization and biological evaluation of new symmetrical biscationic compounds as selective inhibitors of human Choline Kinase α 1 (ChoK α 1).
[4]. Mariotto E, et al. Choline Kinase Alpha Inhibition by EB-3D Triggers Cellular Senescence, Reduces Tumor Growth and Metastatic Dissemination in Breast Cancer. Cancers (Basel). 2018;10(10):391. Published 2018 Oct 22.

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。

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

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
H2O/DMSO	**1 mM**	1.5517 mL	7.7587 mL	15.5173 mL	38.7934 mL
	5 mM	0.3103 mL	1.5517 mL	3.1035 mL	7.7587 mL
	10 mM	0.1552 mL	0.7759 mL	1.5517 mL	3.8793 mL
DMSO	**15 mM**	0.1034 mL	0.5172 mL	1.0345 mL	2.5862 mL
	20 mM	0.0776 mL	0.3879 mL	0.7759 mL	1.9397 mL
	25 mM	0.0621 mL	0.3103 mL	0.6207 mL	1.5517 mL
	30 mM	0.0517 mL	0.2586 mL	0.5172 mL	1.2931 mL
	40 mM	0.0388 mL	0.1940 mL	0.3879 mL	0.9698 mL
	50 mM	0.0310 mL	0.1552 mL	0.3103 mL	0.7759 mL
	60 mM	0.0259 mL	0.1293 mL	0.2586 mL	0.6466 mL

备注：如您选择水作为储备液，请稀释至工作液后，再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。