



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: **TBK1/IKK ϵ -IN-5**

CAS 号: **1893397-65-3**

产品货号: **S87655**

生物活性:

Description	TBK1/IKK ε -IN-5 (compound 1) 是一种口服有效的 TBK1 和 IKK ε 的双重抑制剂, 其 IC50 值分别为 1 nM 和 5.6 nM. TBK1/IKK ε -IN-5 能增强对 PD-1 的阻断反应, 与 anti-PD-L1 联用时能诱导大鼠的免疫记忆. TBK1/IKK ε -IN-5 可用于癌症, 尤其是肿瘤免疫的研究。				
IC50 & Target	IC50: 1 nM (TBK1), 5.6 nM (IKK ε) [1].				
In Vitro	TBK1/IKK ε -IN-5 (0.001-10 μM; 24 或 96 小时) 促进纯化的 CD4+ 和 CD8+ T 细胞中 IL-2 和 IFN-γ 的分泌以及 Jurkat 人 T 细胞白血病细胞中 IL-2 的分泌[1]。				
	TBK1/IKK ε -IN-5 有效阻断 CT26 细胞系球体产生的免疫抑制性细胞因子, 且无细胞毒性作用 [1].				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:	CD4+ and CD8+ T cells, Jurkat T cell leukemia cells			
	Concentration:	0.001-10 μM			
	Incubation Time:	24 h (for IL-2); 96 h(for IFN-γ)			
In Vivo	Result:	Enhanced secretion of IL-2 and IFN-γ.			
	TBK1/IKK ε -IN-5 (40 mg/kg; 口服; 每日一次, 持续 26 天) 显示出良好的抗肿瘤活性并延长生存期, 并在与抗 PD-L1 联合使用时诱导小鼠 CT26 细胞的免疫记忆[1].				
	Animal Model:	Female Balb/c mice (11 to 12-week-old; bearing CT26 tumors)[1].			
	Dosage:	40 mg/kg			
	Administration:	Oral gavage; single daily for 26 days (combine with anti-PD-L1).			
	Result:	Exhibited greater tumor control and longer survival when combined with anti-PD-L1 than used alone of both agents Induced immunologic memory of CT26 cells in mice when combined with anti-PD-L1.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 6.67 mg/mL (12.99 mM; 超声助溶 (<60°C); 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	1.9471 mL	9.7354 mL	19.4708 mL
		5 mM	0.3894 mL	1.9471 mL	3.8942 mL
		10 mM	0.1947 mL	0.9735 mL	1.9471 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;					



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

	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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 0.67 mg/mL (1.30 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 0.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 6.7 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]. Jenkins RW, et al. Ex Vivo Profiling of PD-1 Blockade Using Organotypic Tumor Spheroids. Cancer Discov. 2018 Feb;8(2):196-215.

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	1.9471 mL	9.7354 mL	19.4708 mL	48.6770 mL
	5 mM	0.3894 mL	1.9471 mL	3.8942 mL	9.7354 mL
	10 mM	0.1947 mL	0.9735 mL	1.9471 mL	4.8677 mL

源叶