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：NKP-1339
CAS 号：197723-00-5
产品货号：S87696

生物活性：

Description

BOLD-100 (NKP-1339; IT-139) 是针对实体癌开发的一流钌抗癌试剂，副作用小。BOLD-100 通过线粒体途径诱导 G2/M 细胞周期停滞，DNA 合成阻断 (DNA synthesis) 和诱导细胞凋亡 (apoptosis)。BOLD-100 具有很高的肿瘤靶向潜力，与血清蛋白 (serum proteins) 如白蛋白和转铁蛋白强烈结合，并在还原性肿瘤环境中激活。

In Vitro

BOLD-100 (0-200 μM；72 小时) 对多种来源的恶性细胞系具有抗癌活性，对 KP1339 单一疗法的 IC50 值为 45-200 μM。它对肝癌细胞系、Hep3B、HepG2、PLC/PRF/5 和 HCC2 细胞的平均 IC50 值分别为 186.3 μM、165.4 μM、124.4 μM 和 69.4 μM。它对黑色素瘤细胞系 VM-1、VM-21、VM-48 的 IC50 值分别为 178 μM、111 μM 和 143 μM。抗肺癌和结肠癌细胞系，分别抑制 A549、VL-8、SW480 和 HCT116 细胞[2]。

BOLD-100 (0-150 μM；24 小时) 诱导细胞凋亡。当它与 Sorafenib (HY-10201) 联合使用时，它会增加凋亡细胞的数量。且 p-PARP 和半胱天冬酶 7 的裂解得到促进[2]。

BOLD-100 (0-150 μM；24 小时) 可以促进 STAT3 和 CREB 表达的磷酸化[2]。

Cell Viability Assay[2]

Cell Line:	Hepatoma, Melanoma, Lung cancer and Colon cancer cell lines
Concentration:	0 μM, 50 μM, 100 μM, 150 μM and 200 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Has anti-cancer activity in diverse malignant tumour cell types.

Apoptosis Analysis[2]

Cell Line:	Hep3B cells
Concentration:	0 μM, 75 μM, 150 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Promoted cell apoptosis as a concentration manner.

Western Blot Analysis[2]

Cell Line:	Hep3B cells
Concentration:	0 μM, 75 μM, 150 μM
Incubation Time:	72 hours
Result:	Increased p-STAT3 and p-CREB expression in cells without sorafenib cotreatment.

In Vivo

BOLD-100 (30 mg/kg；静脉注射；每周一次持续六周) 与多激酶抑制剂 Sorafenib (HY-10201) 结合，对比在 Balb/c SCID 中生长的 Hep3B 异种移植小鼠中单独使用表现出进一步的抗癌活性[2]。

Animal Model:	Hep3B xenograft in Balb/c mice[2]
Dosage:	30 mg/kg
Administration:	Intravenous injection
Result:	Had synergistic activity of KP1339 with sorafenib in vivo.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ： ≥ 59 mg/mL (117.50 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)

* "≥" means soluble, but saturation unknown)

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

	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	1.9915 mL	9.9574 mL	19.9148 mL
		5 mM	0.3983 mL	1.9915 mL	3.9830 mL
		10 mM	0.1991 mL	0.9957 mL	1.9915 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。				
参考文献	[1]. Robert Trondl, et al. NKP-1339, the first ruthenium-based anticancer drug on the edge to clinical application. Chemical Science. Chemical Science. [2]. Heffeter P, et al. The ruthenium compound KP1339 potentiates the anticancer activity of sorafenib in vitro and in vivo. Eur J Cancer. 2013 Oct;49(15):3366-75.				

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
DMSO	1 mM	1.9915 mL	9.9574 mL	19.9148 mL	49.7869 mL
	5 mM	0.3983 mL	1.9915 mL	3.9830 mL	9.9574 mL
	10 mM	0.1991 mL	0.9957 mL	1.9915 mL	4.9787 mL
	15 mM	0.1328 mL	0.6638 mL	1.3277 mL	3.3191 mL
	20 mM	0.0996 mL	0.4979 mL	0.9957 mL	2.4893 mL
	25 mM	0.0797 mL	0.3983 mL	0.7966 mL	1.9915 mL
	30 mM	0.0664 mL	0.3319 mL	0.6638 mL	1.6596 mL
	40 mM	0.0498 mL	0.2489 mL	0.4979 mL	1.2447 mL
	50 mM	0.0398 mL	0.1991 mL	0.3983 mL	0.9957 mL
	60 mM	0.0332 mL	0.1660 mL	0.3319 mL	0.8298 mL
	80 mM	0.0249 mL	0.1245 mL	0.2489 mL	0.6223 mL
	100 mM	0.0199 mL	0.0996 mL	0.1991 mL	0.4979 mL