



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: **KAN0438757**

CAS 号: **1451255-59-6**

产品货号: **S87910**

生物活性:

Description	KAN0438757 是一种有效的选择性代谢酶 PFKFB3 抑制剂, IC50 值为 0.19 μ M。
IC50 & Target	IC50: 0.19 μ M (PFKFB3)[1]
In Vitro	KAN0438757 (72 h) 抑制 Miapaca-2、PANC1、SW620、U-266、AMO-1 的细胞活力 (IC50: 分别为 2.75、3.83、7.50、5.08、11.53 μM)[1]。 KAN0438757 (10 μM, 6 小时) 可降低 U2OS 细胞中的同源重组 (HR) 活性并增加电离辐射 (IR) 诱导的 γH2AX 焦点水平[1]。 KAN0438757 (50 μM, 12 小时) 可降低 HCT-116、SW-1463 和 HUVEC 中 PFKFB3 蛋白的表达[2]。 KAN0438757 (0-50 μM, 24 小时) 可减少 HCT-116 癌细胞和 HUVEC 中的糖酵解[2]。
In Vivo	KAN0438757 (腹腔注射, 10; 25; 50 mg/kg) 耐受性良好, 在 C57BL6/N 小鼠中没有显示出相关的全身毒性作用[2]。

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 : 130 mg/mL (290.55 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)

	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing	1 mM	2.2350 mL	11.1749 mL	22.3499 mL
Stock Solutions	5 mM	0.4470 mL	2.2350 mL	4.4700 mL
	10 mM	0.2235 mL	1.1175 mL	2.2350 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;

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: 2.17 mg/mL (4.85 mM); 澄清溶液; 超声助溶

此方案可获得 2.17 mg/mL 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 21.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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: ≥ 2.17 mg/mL (4.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 21.7 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.17 mg/mL (4.85 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.17 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 21.7 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Gustafsson NMS, et al. Targeting PFKFB3 radiosensitizes cancer cells and suppresses homologous recombination. Nat Commun. 2018 Sep 24;9(1):3872. [2]. De Oliveira T, et al. Effects of the Novel PFKFB3 Inhibitor KAN0438757 on Colorectal Cancer Cells and Its Systemic Toxicity Evaluation In Vivo. Cancers (Basel). 2021 Feb 28;13(5):1011.

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	2.2350 mL	11.1749 mL	22.3499 mL	55.8747 mL
	5 mM	0.4470 mL	2.2350 mL	4.4700 mL	11.1749 mL
	10 mM	0.2235 mL	1.1175 mL	2.2350 mL	5.5875 mL
	15 mM	0.1490 mL	0.7450 mL	1.4900 mL	3.7250 mL
	20 mM	0.1117 mL	0.5587 mL	1.1175 mL	2.7937 mL
	25 mM	0.0894 mL	0.4470 mL	0.8940 mL	2.2350 mL
	30 mM	0.0745 mL	0.3725 mL	0.7450 mL	1.8625 mL
	40 mM	0.0559 mL	0.2794 mL	0.5587 mL	1.3969 mL
	50 mM	0.0447 mL	0.2235 mL	0.4470 mL	1.1175 mL
	60 mM	0.0372 mL	0.1862 mL	0.3725 mL	0.9312 mL
	80 mM	0.0279 mL	0.1397 mL	0.2794 mL	0.6984 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: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0223 mL	0.1117 mL	0.2235 mL	0.5587 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶