



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: **NAPHTHOL AS-E PHOSPHATE; KG-501**

CAS 号: **18228-17-6**

产品货号: **S88062**

生物活性:

Description	KG-501 是 CREB 的抑制剂, 其 IC50 值为 6.89 μ M。			
IC50 & Target	IC50: 6.89 μ M (CREB)[1].			
In Vitro	KG-501 直接靶向 CBP 的 KIX 结构域, 导致 CREB-CBP 复合物断裂, 抑制 CREB 靶基因诱导, 并抑制 IL-1β 介导的非小细胞肺癌 (NSCLC) 中的血管生成活性[1]。 KG-501 可阻断磷酸化 (Ser-133) CREB 与 KIX 的结合, Ki 约为 90 μM, 此时 CREB 浓度处于结合测定的线性范围内。用 KG-501 处理 HEK293T 细胞也能阻断毛喉素对内源性 CREB 靶基因 (NR4A2、αCG、c-fos 和 RGS2) 的诱导, 这表明 KG-501 可能对 CREB 活性具有普遍影响[2]。 KG-501 也能抑制 NF-κB 转录活性, 因为 NF-κB 也需要 CBP 作为辅助因子来调节基因表达。用 IL-1β 加 10 μM KG-501 处理的 A549 细胞, CM 诱导的 HUVEC 迁移显著低于用 IL-1β 单独处理的 A549 细胞。在 10 μM 浓度下, KG-501 抑制除 CXCL8 外所有 IL-1β 诱导的 CXC 趋化因子基因的表达。在蛋白质水平上, KG-501 显著抑制 IL-1β 诱导的 CXCL5 蛋白分泌。在 H1734 细胞系中也观察到了 KG-501 的类似作用[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 6 mg/mL (15.88 mM); 超声加热助溶; 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
		1 mM	2.6475 mL	13.2373 mL
		5 mM	0.5295 mL	2.6475 mL
		10 mM	0.2647 mL	1.3237 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。 -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。 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: $\geq$ 2 mg/mL (5.29 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 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 mg/mL (5.29 mM); 悬浊液 此方案可获得 ≥ 2 mg/mL（饱和度未知）的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.0 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 mg/mL (5.29 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2 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 20.0 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]. Lee JW, et al. A Novel Small-Molecule Inhibitor Targeting CREB-CBP Complex Possesses Anti-Cancer Effects along with Cell Cycle Regulation, Autophagy Suppression and Endoplasmic Reticulum Stress. PLoS One. 2015 Apr 21;10(4):e0122628. [2]. Best JL et al. Identification of small-molecule antagonists that inhibit an activator: coactivator interaction. Proc Natl Acad Sci U S A. 2004 Dec 21;101(51):17622-7 [3]. Sun H, et al. Cyclic AMP-responsive element binding protein- and nuclear factor-kappaB-regulated CXC chemokine gene expression in lung carcinogenesis. Cancer Prev Res (Phila). 2008 Oct;1(5):316-28.

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。-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	2.6475 mL	13.2373 mL	26.4746 mL	66.1866 mL
	5 mM	0.5295 mL	2.6475 mL	5.2949 mL	13.2373 mL
	10 mM	0.2647 mL	1.3237 mL	2.6475 mL	6.6187 mL
	15 mM	0.1765 mL	0.8825 mL	1.7650 mL	4.4124 mL