



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: **BC2059 ; Tegatrabetan**

CAS 号: **1227637-23-1**

产品货号: **S88311**

生物活性:				
Description	Tegatrabetan (BC2059) 是一种 β -Catenin 拮抗剂。Tegatrabetan 破坏 β -catenin 与转导素 β 样蛋白 1 (TBL1) 结合。			
IC50 & Target	β -Catenin[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A549	IC ₅₀	0.05169 μ M	Growth inhibition of human A549 cells after 72 hrs by APH assay
	Cancer cell lines	IC ₅₀	0.02001 μ M	Cytotoxicity against human breast cancer cell aggregates grown on matrigel incubated for 72 hrs by MTS assay
	Cancer cell lines	IC ₅₀	0.02075 μ M	Cytotoxicity against human prostate cancer cells after 72 hrs by MTS assay
	Cancer cell lines	IC ₅₀	0.02992 μ M	Cytotoxicity against human colon cancer cell aggregates grown on matrigel incubated for 72 hrs by MTS assay
	Cancer cell lines	IC ₅₀	0.5305 μ M	Cytotoxicity against human ovarian cancer cell aggregates grown on matrigel incubated for 72 hrs by MTS assay
	HCT-116	IC ₅₀	0.02019 μ M	Growth inhibition of human HCT116 cells after 72 hrs by APH assay
	HCT-15	IC ₅₀	0.03057 μ M	Growth inhibition of human HCT15 cells after 72 hrs by APH assay
	HCT-15	IC ₅₀	0.03806 μ M	Cytotoxicity against human HCT15 cell aggregates grown on matrigel incubated for 72 hrs by MTS assay
	HT-29	GI ₅₀	0.09 μ M	Growth inhibition of human HT-29 cells after 72 hrs by APH assay
	HT-29	IC ₅₀	0.63 μ M	Inhibition of Wnt/ β -catenin transcriptional activity in human HT-29 cells assessed as depletion of β -catenin level by TCF luciferase promoter reporter assay
	MCF7	IC ₅₀	0.08078 μ M	Growth inhibition of human MCF7 cells after 72 hrs by APH assay
	SW480	IC ₅₀	0.02329 μ M	Growth inhibition of human SW480 cells after 72 hrs by APH assay
In Vitro	Tegatrabetan (BC2059; 20-100 nM; 处理 48 小时) 能在悬浮培养条件下持续抑制细胞增殖超过 120 小时, 并剂量依赖性地诱导人急性髓系白血病细胞系 HL-60、OCI-AML3 和 MV4-11 的凋亡[1]。 Tegatrabetan (20 及 50 nM; 处理 24 小时) 可适度但显著地引起细胞周期 G0/G1 期阻滞, 同时伴随 G2/M 期细胞比例下降[1]。 Tegatrabetan (100 nM, 24 小时) 能显著降低 OCI-AML3、HL-60 和 MV4-11 细胞中 β-连环蛋			



	白及其靶基因 (包括 c-MYC 和 survivin) 的表达水平, 但对 TBL1 蛋白含量无显著影响[1]。					
	Cell Proliferation Assay[1]					
	Cell Line:	HL-60, OCI-AML3 and MV4-11 cells				
	Concentration:	20, 50, and 100 nM				
	Incubation Time:	48 hours				
	Result:	Dose-dependently inhibited cell proliferation.				
	Cell Cycle Analysis[1]					
	Cell Line:	OCI-AML3 cells				
	Concentration:	20 and 50 nM				
	Incubation Time:	24 hours				
	Result:	Dose-dependently induced cell cycle growth arrest.				
	Western Blot Analysis[1]					
	Cell Line:	OCI-AML3, HL-60 and MV4-11 cells				
	Concentration:	100 nM				
	Incubation Time:	24 hours				
	Result:	Treatment depleted β -Catenin expression levels.				
In Vivo	Tegatrabetan (BC2059; 1.0 或 5.0 mg/kg/天; 静脉注射) 可显著延长小鼠的中位生存期, 从约 17.5 天提升至 39 天。而单独使用 Tegatrabetan (10 mg/kg/天; 静脉注射)治疗时, 中位生存期进一步延长至 51.5 天[1]。					
	Animal Model:	NOD/SCID mice bearing OCI-AML3 xenografts[1]				
	Dosage:	1 mg/kg; 5 mg/kg; 10 mg/kg				
	Administration:	Intravenously; 1 mg/kg daily 4 days per week or 5 mg/kg or 10 mg/kg of BC2059 twice per week (Tuesday and Thursday) for 3 weeks.				
	Result:	Treatment significantly improved survival of NOD/SCID mice bearing OCI-AML3 xenografts.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (84.93 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	1 mg	5 mg	10 mg
		Concentration				
			1 mM	1.6985 mL	8.4927 mL	16.9854 mL
		5 mM	0.3397 mL	1.6985 mL	3.3971 mL	
		10 mM	0.1699 mL	0.8493 mL	1.6985 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: 2.5 mg/mL (4.25 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 25.0 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: 2.5 mg/mL (4.25 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 25.0 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: $\geq$ 2.5 mg/mL (4.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 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 25.0 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]. Fiskus W, et al. Pre-clinical efficacy of combined therapy with novel β -catenin antagonist BC2059 and histone deacetylase inhibitor against AML cells. Leukemia. 2015 Jun;29(6):1267-78.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。 -80 $^{\circ}$ C 储存时,请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	1.6985 mL	8.4927 mL	16.9854 mL	42.4636 mL
	5 mM	0.3397 mL	1.6985 mL	3.3971 mL	8.4927 mL
	10 mM	0.1699 mL	0.8493 mL	1.6985 mL	4.2464 mL
	15 mM	0.1132 mL	0.5662 mL	1.1324 mL	2.8309 mL
	20 mM	0.0849 mL	0.4246 mL	0.8493 mL	2.1232 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

	25 mM	0.0679 mL	0.3397 mL	0.6794 mL	1.6985 mL
	30 mM	0.0566 mL	0.2831 mL	0.5662 mL	1.4155 mL
	40 mM	0.0425 mL	0.2123 mL	0.4246 mL	1.0616 mL
	50 mM	0.0340 mL	0.1699 mL	0.3397 mL	0.8493 mL
	60 mM	0.0283 mL	0.1415 mL	0.2831 mL	0.7077 mL
	80 mM	0.0212 mL	0.1062 mL	0.2123 mL	0.5308 mL



源叶