



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: **KY-226**
CAS 号: **1621673-53-7**
产品货号: **S88446**

生物活性:

Description	KY-226 是一种有效的, 选择性的, 口服活性的和变构蛋白酪氨酸磷酸酶 1B (PTP1B) 抑制剂, IC50 为 0.25 μM, 且不激活 PPAR γ。KY-226 通过增强胰岛素和瘦素信号传导发挥抗糖尿病和抗肥胖作用。KY-226 还可以保护神经元免受脑缺血损伤。				
IC50 & Target[1]	IC50: 0.25 μM (Protein tyrosine phosphatase 1B (PTP1B))[2]				
In Vitro	KY-226 (0.3-10 μM) 在人肝癌衍生细胞 (HepG2) 中可增加胰岛素产生的磷酸化胰岛素受体 (pIR)[1]。 KY-226 (1 μM; 24 小时; bEnd.3 细胞) 处理可挽救脂多糖诱导的 ZO-1 mRNA 和蛋白质水平降低。KY-226 可恢复 bEnd.3 细胞中 pAkt (T308) 及其下游目标叉头框蛋白 O1 (FoxO1) (S256) 的磷酸化[2]。 Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	bEnd.3 cells stimulated with LPS			
	Concentration:	1 μM			
	Incubation Time:	24 hours			
	Result:	Rescued lipopolysaccharide-induced reduction of mRNA and protein levels of ZO-1.			
In Vivo	KY-226 (10-30 mg/kg/天; 口服给药; 每天; 持续 4 周; 雄性 db/db 小鼠) 处理可显著降低血浆葡萄糖和甘油三酯水平以及血红蛋白 A1c 值, 而无需增加体重[1]。 KY-226 可减轻口服葡萄糖耐量试验中的血浆葡萄糖升高。KY-226 还会增加肝脏和股骨肌肉中的 pIR 和磷酸化 Akt[1]。				
	Animal Model:	Male db/db mice (8-11 weeks old)[1]			
	Dosage:	10 mg/kg and 30 mg/kg			
	Administration:	Oral administration; daily; for 4 weeks			
	Result:	Significantly reduced plasma glucose and triglyceride levels as well as hemoglobin A1c values without increasing body weight gain.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (519.03 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0761 mL	10.3806 mL	20.7611 mL
		5 mM	0.4152 mL	2.0761 mL	4.1522 mL
		10 mM	0.2076 mL	1.0381 mL	2.0761 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.32 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.32 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 20.8 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.32 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 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 20.8 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]. Ito Y, et al. Therapeutic effects of the allosteric protein tyrosine phosphatase 1B inhibitor KY-226 on experimental diabetes and obesity via enhancements in insulin and leptin signaling in mice. J Pharmacol Sci. 2018 May;137(1):38-46. [2]. Sun M, et al. KY-226 Protects Blood-brain Barrier Function Through the Akt/FoxO1 Signaling Pathway in Brain Ischemia. Neuroscience. 2019 Feb 10;399:89-102.

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	2.0761 mL	10.3806 mL	20.7611 mL	51.9028 mL
	5 mM	0.4152 mL	2.0761 mL	4.1522 mL	10.3806 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: shyyssw@sina.com

	10 mM	0.2076 mL	1.0381 mL	2.0761 mL	5.1903 mL
	15 mM	0.1384 mL	0.6920 mL	1.3841 mL	3.4602 mL
	20 mM	0.1038 mL	0.5190 mL	1.0381 mL	2.5951 mL
	25 mM	0.0830 mL	0.4152 mL	0.8304 mL	2.0761 mL
	30 mM	0.0692 mL	0.3460 mL	0.6920 mL	1.7301 mL
	40 mM	0.0519 mL	0.2595 mL	0.5190 mL	1.2976 mL
	50 mM	0.0415 mL	0.2076 mL	0.4152 mL	1.0381 mL
	60 mM	0.0346 mL	0.1730 mL	0.3460 mL	0.8650 mL
	80 mM	0.0260 mL	0.1298 mL	0.2595 mL	0.6488 mL
	100 mM	0.0208 mL	0.1038 mL	0.2076 mL	0.5190 mL



源叶