



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Compound E**  
CAS 号: **209986-17-4**  
产品货号: **S88573**

|                           |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                |            |                                                                                                                                                                                        |
|---------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 生物活性:                     |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |                                |            |                                                                                                                                                                                        |
| Description               | Compound E 是 $\gamma$ -secretase 抑制剂。Compound E 抑制 $\beta$ -amyloid(40), $\beta$ -amyloid(42), 和 Notch $\gamma$ -分泌酶切割的 IC50 值分别为 0.24, 0.37, 0.32 nM。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |                                |            |                                                                                                                                                                                        |
| IC50 & Target             | IC50: 0.24 nM ( $\beta$ -amyloid(40)), 0.37 nM ( $\beta$ -amyloid(42)), 0.24 nM (Notch)[1]                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                |            |                                                                                                                                                                                        |
| Cellular Effect           | Cell Line                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | Type                           | Value      | Description                                                                                                                                                                            |
|                           | SH-SY5Y                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | IC <sub>50</sub>               | 1 nM       | Displacement of [3H]5-chloro-N-((2S,3R)-5,5,5-trifluoro-1-hydroxy-3-methylpentan-2-yl)thiophene-2-sulfonamide from gamma secretase in human SH-SY5Y cells by competitive binding assay |
| Cellular Effect           | SH-SY5Y                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | IC <sub>50</sub>               | 2.7 nM     | Inhibition of gamma secretase-mediated amyloid beta (1 to 40) production in human SH-SY5Y cells                                                                                        |
| In Vitro                  | Compound E (50 $\mu$ M) 可使 T47D 和 MCF-7 细胞系的增殖减少不到 50%[1]。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |                                |            |                                                                                                                                                                                        |
| Solvent&Solubility        | <b>细胞实验:</b><br>DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (203.87 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                                                                                                                                                                                   |
| Preparing Stock Solutions | 1 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 2.0387 mL                      | 10.1937 mL | 20.3874 mL                                                                                                                                                                             |
|                           | 5 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                  | 0.4077 mL                      | 2.0387 mL  | 4.0775 mL                                                                                                                                                                              |
| Preparing Stock Solutions | 10 mM                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | 0.2039 mL                      | 1.0194 mL  | 2.0387 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。<br>储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-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。<br><b>动物实验:</b><br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br>方案 一<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil<br>Solubility: $\geq 2.88$ mg/mL (5.87 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 $\geq 2.88$ 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。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 28.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 $\mu$ L 玉米油中, 混合均匀。<br>方案 二<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline |                                |            |                                                                                                                                                                                        |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 |
|------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>Solubility: 2.5 mg/mL (5.10 mM); 悬浊液; 超声助溶</p> <p>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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 <math>\mu</math>L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 <math>\mu</math>L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 <math>\mu</math>L 生理盐水 定容至 1 mL。</p> <p>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO <math>\rightarrow</math> 90% (20% SBE-<math>\beta</math>-CD in Saline)</p> <p>Solubility: <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (5.10 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 <math>\geq</math> 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 20% 的 SBE-<math>\beta</math>-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。</p> <p>2 g SBE-<math>\beta</math>-CD (磺丁基醚 <math>\beta</math>-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。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Beher D, et al. Pharmacological knock-down of the presenilin 1 heterodimer by a novel gamma-secretase inhibitor: implications for presenilin biology. J Biol Chem. 2001 Nov 30;276(48):45394-402.</p> <p>[2]. Rasul S, et al. Inhibition of gamma-secretase induces G2/M arrest and triggers apoptosis in breast cancer cells. Br J Cancer. 2009 Jun 16;100(12):1879-88.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                            |

#### 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 (sealed storage, away from moisture and light)。-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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 2.0387 mL | 10.1937 mL | 20.3874 mL | 50.9684 mL |
|      | 5 mM             | 0.4077 mL | 2.0387 mL  | 4.0775 mL  | 10.1937 mL |
|      | 10 mM            | 0.2039 mL | 1.0194 mL  | 2.0387 mL  | 5.0968 mL  |
|      | 15 mM            | 0.1359 mL | 0.6796 mL  | 1.3592 mL  | 3.3979 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1019 mL | 0.5097 mL  | 1.0194 mL  | 2.5484 mL  |
|      | 25 mM            | 0.0815 mL | 0.4077 mL  | 0.8155 mL  | 2.0387 mL  |
|      | 30 mM            | 0.0680 mL | 0.3398 mL  | 0.6796 mL  | 1.6989 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0510 mL | 0.2548 mL  | 0.5097 mL  | 1.2742 mL  |
|      | 50 mM            | 0.0408 mL | 0.2039 mL  | 0.4077 mL  | 1.0194 mL  |
|      | 60 mM            | 0.0340 mL | 0.1699 mL  | 0.3398 mL  | 0.8495 mL  |
|      | 80 mM            | 0.0255 mL | 0.1274 mL  | 0.2548 mL  | 0.6371 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyysw@sina.com

|  |        |           |           |           |           |
|--|--------|-----------|-----------|-----------|-----------|
|  | 100 mM | 0.0204 mL | 0.1019 mL | 0.2039 mL | 0.5097 mL |
|--|--------|-----------|-----------|-----------|-----------|



源叶