



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: **USP25 and 28 inhibitor AZ-1**

CAS 号: **2165322-94-9**

产品货号: **S88588**

生物活性:

Description	USP25/28 inhibitor AZ1 (AZ1) 是一种口服有效, 选择性, 非竞争性的双重泛素特异性蛋白酶 USP25/28 抑制剂, IC50 分别为 0.7 μM, 0.6 μM。USP25/28 inhibitor AZ1 可减轻小鼠模型的结肠炎和肿瘤发生。				
IC50 & Target	IC50: 0.7 μM (USP25) and 0.6 μM (USP28)[1]				
In Vivo	USP25/28 inhibitor AZ1 (AZ1; 40 mg/kg; 管饲; 每日一次; 共 7 天) 可预防 Dextran sulfate sodium salt (HY-116282C) (DSS) 引起的体重减轻和腹泻, 以及结肠缩短受损[1]。				
	USP25/28 inhibitor AZ1 (20 mg/kg/天; 管饲; 第 1、3、6 周, 每周 6 次) 治疗可显著减少结肠中的肿瘤数量。肿瘤中 Wnt 相关基因表达和 pSTAT3 水平降低, SOCS3 水平升高。USP25/28 inhibitor AZ1 管饲疗法无法缓解 Usp25 ^{-/-} 小鼠中 DSS 诱发的结肠炎或 Il10 ^{-/-} 小鼠中自发性的结肠炎[1]。				
	USP25/28 inhibitor AZ1 (20 mg/kg/天; 管饲; 每 3 天一次, 持续 13-20 周) 可显著抑制结肠肿瘤形成, 并延长 AOM/Vil-Cre;Trp53fl/fl (VP) 小鼠的生存期。在 USP25 缺陷型小鼠中, USP25/28 inhibitor AZ1 治疗对肿瘤形成的影响微乎其微[1]。				
	Animal Model:	12-week old male Usp25 ^{+/+} and Usp25 ^{-/-} mice[1]			
	Dosage:	40 mg/kg			
	Administration:	Gavage; daily; for 7 days			
Solvent&Solubility	Result:	Protected from dextran sulfate sodium (DSS)-induced weight loss and diarrhea and impaired colon shortening and potentiated the expression of proinflammatory cytokines and antibacterial peptides in colons of Usp25 ^{-/-} mice compared to control counterparts.			
	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 250 mg/mL (592.12 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3685 mL	11.8424 mL	23.6849 mL
5 mM		0.4737 mL	2.3685 mL	4.7370 mL	
10 mM	0.2368 mL	1.1842 mL	2.3685 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.93 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 (4.93 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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 (4.93 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。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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： Corn Oil Solubility: 25 mg/mL (59.21 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Wrigley JD, et al. Identification and Characterization of Dual Inhibitors of the USP25/28 Deubiquitinating Enzyme Subfamily. ACS Chem Biol. 2017 Dec 15;12(12):3113-3125. [2]. Xiao-Meng Wang, et al. The deubiquitinase USP25 supports colonic inflammation and bacterial infection and promotes colorectal cancer. Nature Cancer volume 1, pages811–825(2020).

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	2.3685 mL	11.8424 mL	23.6849 mL	59.2122 mL
	5 mM	0.4737 mL	2.3685 mL	4.7370 mL	11.8424 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	0.2368 mL	1.1842 mL	2.3685 mL	5.9212 mL
	15 mM	0.1579 mL	0.7895 mL	1.5790 mL	3.9475 mL
	20 mM	0.1184 mL	0.5921 mL	1.1842 mL	2.9606 mL
	25 mM	0.0947 mL	0.4737 mL	0.9474 mL	2.3685 mL
	30 mM	0.0789 mL	0.3947 mL	0.7895 mL	1.9737 mL
	40 mM	0.0592 mL	0.2961 mL	0.5921 mL	1.4803 mL
	50 mM	0.0474 mL	0.2368 mL	0.4737 mL	1.1842 mL
	60 mM	0.0395 mL	0.1974 mL	0.3947 mL	0.9869 mL
	80 mM	0.0296 mL	0.1480 mL	0.2961 mL	0.7402 mL
	100 mM	0.0237 mL	0.1184 mL	0.2368 mL	0.5921 mL



源叶