



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: **CS-2853; BTSA1**

CAS 号: **314761-14-3**

产品货号: **S88646**

生物活性:

生物活性:		
Description	BTSA1 是一种有效的, 高亲和力和口服活性的 BAX 激活剂, IC50 为 250 nM, EC50 为 144 nM. BTSA1 以高亲和力和特异性与 N 末端激活位点结合, 并诱导 BAX 发生构象变化, 从而导致 BAX 介导的细胞凋亡。	
IC50 & Target[1]	Bax 250 nM (IC50)	Bax 144 nM (EC50)
In Vitro	BTSA1 (5 μM; 6-24 小时; 人类 AML 细胞系) 治疗降低了所有 AML 细胞系的活力, 并在 6 小时内显示出显著的细胞死亡活性[1]。	
	BTSA1 (2.5-10 μM; 6 小时; NB4 细胞) 治疗诱导 BAX 易位, 同时细胞色素 c 从线粒体释放到细胞溶胶。显著的 BAX 线粒体易位以 BTSA1 剂量依赖性方式诱导[1]。	
	BTSA1 (0.15625-10 μM; 4-24 小时; OCI-AML3 细胞) 治疗诱导 OCI-AML3 细胞中剂量依赖性 caspase-3/7 活化。在 4-24 小时内监测 Caspase-3/7 活化, 并在 4 小时内检测到最大 caspase-3/7 活化[1]。	
	Cell Viability Assays ^{sup} [1]	
	Cell Line:	Human AML cell lines<
	Concentration:	5 μM
	Incubation Time:	6 hours, 12 hours, 24 hours
	Result:	Reduced viability of all AML cell lines. Displayed substantial cell death activity within 6 hours.
	Western Blot Analysis[1]	
	Cell Line:	NB4 cells
	Concentration:	2.5 μM, 5 μM, 10 μM
	Incubation Time:	6 hours
	Result:	Significant BAX mitochondrial translocation was induced in a dose-dependent manner.
	Apoptosis Analysis[1]	
	Cell Line:	OCI-AML3 cells
Concentration:	0.15625 μM, 0.3125 μM, 0.625 μM, 1.25 μM, 2.5 μM, 5 μM, 10 μM	
Incubation Time:	4 hours, 6 hours, 8 hours, 12 hours, 24 hours	
Result:	Induced dose-dependent caspase-3/7 activation in OCI-AML3 cells. Caspase-3/7 activation was monitored within 4-24 hr and maximal caspase-3/7 activation was detected in 4 hr.	
In Vivo	与接受载体治疗的小鼠相比, BTSA1 (10 mg/kg; 腹腔内注射; 每两天一次; NOD-SCID IL2R γ 缺陷 (NSG) 小鼠) 治疗可显著提高存活率。BTSA1 治疗可显著抑制白血病生长[1]。	
	Animal Model:	NOD-SCID IL2R 纬 null (NSG) mice (6-8 weeks old) with THP-1 cells[1]
	Dosage:	10 mg/kg
	Administration:	Intraperitoneal injection; every two days
	Result:	Significantly increased survival when compared to vehicle-treated mice.



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

Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (58.07 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	2.3228 mL	11.6141 mL	23.2283 mL
		5 mM	0.4646 mL	2.3228 mL	4.6457 mL
10 mM		0.2323 mL	1.1614 mL	2.3228 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。					
参考文献	[1]. Reyna DE, et al. Direct Activation of BAX by BTSA1 Overcomes Apoptosis Resistance in Acute Myeloid Leukemia. Cancer Cell. 2017 Oct 9;32(4):490-505.e10.				

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	2.3228 mL	11.6141 mL	23.2283 mL	58.0707 mL
	5 mM	0.4646 mL	2.3228 mL	4.6457 mL	11.6141 mL
	10 mM	0.2323 mL	1.1614 mL	2.3228 mL	5.8071 mL
	15 mM	0.1549 mL	0.7743 mL	1.5486 mL	3.8714 mL
	20 mM	0.1161 mL	0.5807 mL	1.1614 mL	2.9035 mL
	25 mM	0.0929 mL	0.4646 mL	0.9291 mL	2.3228 mL
	30 mM	0.0774 mL	0.3871 mL	0.7743 mL	1.9357 mL
	40 mM	0.0581 mL	0.2904 mL	0.5807 mL	1.4518 mL
	50 mM	0.0465 mL	0.2323 mL	0.4646 mL	1.1614 mL