



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: **C188-9**
CAS 号: **432001-19-9**
产品货号: **S88670**

生物活性:

Description	C188-9 (TTI-101) 是 Stat3 的抑制剂, 其 Kd 值为 4.7 nM。C188-9 抑制 G-CSF 诱导的 STAT3 激活和 STAT3 依赖性基因表达。C188-9 诱导 AML 细胞系和原代标本凋亡, 抑制原代 AML 细胞集落形成。			
IC50 & Target[1]	STAT3 4.7 nM (Kd)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	AGS	IC ₅₀	9.99 μ M	Antiproliferative activity against human AGS cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
	GDM-1	EC ₅₀	6 μ M	Induction of apoptosis in human GDM-1 cells incubated for 48 hrs by Annexin V staining assay
	Kasumi 1	EC ₅₀	8 μ M	Induction of apoptosis in human Kasumi 1 cells incubated for 48 hrs by Annexin V staining assay
	MCF7	EC ₅₀	13.75 μ M	Antiproliferative activity against human MCF7 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 72 hrs by CyQuant assay
	MDA-MB-231	EC ₅₀	25.7 μ M	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells harbouring STAT3 assessed as reduction in cell viability at upto 10 μ M incubated for 72 hrs by CyQuant assay
	MGC-803	IC ₅₀	3.26 μ M	Antiproliferative activity against human MGC-803 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
	MKN-1	IC ₅₀	10.21 μ M	Antiproliferative activity against human MKN-1 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
	MKN-28	IC ₅₀	40.01 μ M	Antiproliferative activity against human MKN-28 cells assessed as inhibition of cell growth incubated for 72 hrs by CCK-8 assay
In Vitro	C188-9 是一种 Stat3 抑制剂, Kd 为 4.7 nM[1]。 C188-9 抑制 AML 细胞系中 Stat3 活化的 IC ₅₀ 在 4-7 μ M 范围内, 在原发性 AML 样本中, IC ₅₀ 在 8-18 μ M 范围内。对于细胞凋亡研究, 用 C188-9 处理 AML 细胞系和原发性样本 24 小时, 然后通过 FACS 分析对膜联蛋白 V 标记细胞的凋亡细胞进行量化。诱导细胞凋亡的 EC ₅₀ 变化很大, 范围从 6 μ M 到 50 μ M 以上[2]。			
In Vivo	在约 13,528 个可识别基因中, 37 个基因转录本的水平受到 C188 的影响(17 个基因下调, 20 个基因上调, $\text{fdr} < 0.01$, 倍数变化 ≥ 1.5), 其中 7 个是已知的 STAT3 基因靶标。相比之下, C188-9 影响的与致癌作用有关的基因数量要多得多(共 384 个, 95 个基因下调, 289 个基因上调), 包括 76 个之前报告的受 STAT3 调控的基因(38 个基因下调, 38 个基因上调)。在之前显示受 STAT3 上			



	调的 38 个基因中, 24 个 (63%) 基因在 C188-9 处理后下调, 这与预期一致。此外, C188-9 还下调了 10 个基因 (fdr <0.01, 倍数变化 ≥1.5), 而之前这些基因被 STAT1 上调。因此, 在 48 个 (83.3%) 被 C188-9 下调的基因中, 有 40 个基因之前被证实受 STAT1 正向调控, 其中 16 个基因被证实受 STAT3 和 STAT1 共同调控。该分析提出了这样一种可能性: C188-9 对 HNSCC 肿瘤中基因转录水平的影响是由其对 STAT3 和 STAT1 的影响介导的[3].																								
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (53.02 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)																								
	<table><tr><th rowspan="2">Preparing Stock Solutions</th><th>Solvent / Mass / Concentration</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><th></th><th></th><th></th><th></th></tr><tr><td></td><td>1 mM</td><td>2.1208 mL</td><td>10.6040 mL</td><td>21.2080 mL</td></tr><tr><td></td><td>5 mM</td><td>0.4242 mL</td><td>2.1208 mL</td><td>4.2416 mL</td></tr><tr><td></td><td>10 mM</td><td>0.2121 mL</td><td>1.0604 mL</td><td>2.1208 mL</td></tr></table>	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg						1 mM	2.1208 mL	10.6040 mL	21.2080 mL		5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2416 mL		10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 mL
	Preparing Stock Solutions		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																			
		1 mM	2.1208 mL	10.6040 mL	21.2080 mL																				
	5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2416 mL																					
	10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 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 (protect from 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。 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 (4.41 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。																								
参考文献	[1]. Silva KA, et al. Inhibition of Stat3 activation suppresses caspase-3 and the ubiquitin-proteasome system, leading to preservation of muscle mass in cancer cachexia. J Biol Chem. 2015 Apr 24;290(17):11177-87. [2]. Redell MS, et al. Stat3 signaling in acute myeloid leukemia: ligand-dependent and -independent activation and induction of apoptosis by a novel small-molecule Stat3 inhibitor. Blood. 2011 May 26;117(21):5701-9. [3]. Bharadwaj U, et al. Small-molecule inhibition of STAT3 in radioresistant head and neck squamous cell carcinoma. Oncotarget. 2016 May 3;7(18):26307-30. [4]. Redell MS, et al. Stat3 signaling in acute myeloid leukemia: ligand-dependent and -independent activation and induction of apoptosis by a novel small-molecule Stat3 inhibitor. Blood. 2011;117(21):5701-5709.																								



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

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 (protect from 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1208 mL	10.6040 mL	21.2080 mL	53.0200 mL
	5 mM	0.4242 mL	2.1208 mL	4.2416 mL	10.6040 mL
	10 mM	0.2121 mL	1.0604 mL	2.1208 mL	5.3020 mL
	15 mM	0.1414 mL	0.7069 mL	1.4139 mL	3.5347 mL
	20 mM	0.1060 mL	0.5302 mL	1.0604 mL	2.6510 mL
	25 mM	0.0848 mL	0.4242 mL	0.8483 mL	2.1208 mL
	30 mM	0.0707 mL	0.3535 mL	0.7069 mL	1.7673 mL
	40 mM	0.0530 mL	0.2651 mL	0.5302 mL	1.3255 mL
	50 mM	0.0424 mL	0.2121 mL	0.4242 mL	1.0604 mL

源叶