



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: **K-604 dihydrochloride**

CAS 号: **217094-32-1**

产品货号: **S89126**

生物活性:

Description	K-604 dihydrochloride 是一种有效的选择性酰基辅酶 A:胆固醇酰基转移酶 1 (ACAT-1) 抑制剂, IC50 为 $0.45 \pm 0.06 \mu\text{M}$ 。				
IC50 & Target[1]	ACAT-1 $0.45 \mu\text{M}$ (IC50)	ACAT-2 $102.85 \mu\text{M}$ (IC50)			
In Vitro	K-604 可有效抑制人类巨噬细胞中的胆固醇酯化, IC50 值为 68 nM [1]。 在无细胞生化测定中, $0.5 \mu\text{M}$ 的 K604 可抑制 70% 的 ACAT1 酶活性, 而不会显著抑制 ACAT2 酶活性[2]。				
In Vivo	K-604 仅在最高测试剂量 (30 mg/kg) 下显著降低高脂小鼠血浆胆固醇水平, 但在较低剂量 ($1\text{-}10 \text{ mg/kg}$) 下无此影响[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: H2O 中的溶解度 : 100 mg/mL (173.72 mM ; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 58.33 mg/mL (101.33 mM ; 超声助溶 ($<60^\circ\text{C}$); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	1.7372 mL	8.6860 mL	17.3720 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3474 mL	1.7372 mL	3.4744 mL
		10 mM	0.1737 mL	0.8686 mL	1.7372 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 (sealed storage, away from moisture)。 -80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 $0.22 \mu\text{m}$ 的滤膜过滤除菌后使用。 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: $\geq 2.25 \text{ mg/mL}$ (3.91 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.25 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \mu\text{L}$ 22.5 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $400 \mu\text{L}$ PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 $50 \mu\text{L}$ Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 $450 \mu\text{L}$ 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: ≥ 2.25 mg/mL (3.91 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 22.5 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: ≥ 2.25 mg/mL (3.91 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.25 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 22.5 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: PBS Solubility: 100 mg/mL (173.72 mM); 澄清溶液; 超声助溶 (<60°C)。
参考文献	[1]. Ikenoya M, et al. A selective ACAT-1 inhibitor, K-604, suppresses fatty streak lesions in fat-fed hamsters without affecting plasma cholesterol levels. <i>Atherosclerosis</i>. 2007 Apr;191(2):290-7. [2]. Shibuya Y, et al. Acyl-coenzyme A:cholesterol acyltransferase 1 blockage enhances autophagy in the neurons of triple transgenic Alzheimer's disease mouse and reduces human P301L-tau content at the presymptomatic stage. <i>Neurobiol Aging</i>. 2015 Jul;36(7):2248-2259.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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 / H2O	1 mM	1.7372 mL	8.6860 mL	17.3720 mL	43.4299 mL
	5 mM	0.3474 mL	1.7372 mL	3.4744 mL	8.6860 mL
	10 mM	0.1737 mL	0.8686 mL	1.7372 mL	4.3430 mL
	15 mM	0.1158 mL	0.5791 mL	1.1581 mL	2.8953 mL
	20 mM	0.0869 mL	0.4343 mL	0.8686 mL	2.1715 mL
	25 mM	0.0695 mL	0.3474 mL	0.6949 mL	1.7372 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: shyysw@sina.com

	30 mM	0.0579 mL	0.2895 mL	0.5791 mL	1.4477 mL
	40 mM	0.0434 mL	0.2171 mL	0.4343 mL	1.0857 mL
	50 mM	0.0347 mL	0.1737 mL	0.3474 mL	0.8686 mL
	60 mM	0.0290 mL	0.1448 mL	0.2895 mL	0.7238 mL
	80 mM	0.0217 mL	0.1086 mL	0.2171 mL	0.5429 mL
	100 mM	0.0174 mL	0.0869 mL	0.1737 mL	0.4343 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。



源叶