



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: **KDM5-C70**
CAS 号: **1596348-32-1**
产品货号: **S89129**

生物活性:				
Description	KDM5-C70 是一种 KDM5-C49 的乙酯衍生物,是一种有效的,细胞可渗透的泛 KDM5 组蛋白脱甲基酶抑制剂。KDM5-C70 在骨髓瘤细胞中具有抗增殖作用,从而导致 H3K4me3 水平在全基因组范围内升高。			
IC50 & Target	KDM5			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	MCF7	IC ₅₀	< 1 μM	Antiproliferative activity against human MCF7 cells assessed as reduction in cell viability after 120 hrs by ATPlite assay
	MM1.S	EC ₅₀	3.1 μM	Antiproliferative activity against human MM1.S cells assessed as reduction in cell viability
	U2OS	IC ₅₀	< 1 μM	Inhibition of KDM5B in human U2OS cells assessed as reduction in demethylation of H3K4me3 after 20 hrs by Hoechst 33342 staining based immunofluorescence assay
	U2OS	IC ₅₀	< 1 μM	Inhibition of KDM5C in human U2OS cells assessed as reduction in demethylation of H3K4me3 after 20 hrs by Hoechst 33342 staining based immunofluorescence assay Inhibition of KDM5C in human U2OS cells assessed as reduction in demethylation of H3K4me3 after 20 hrs by Hoechst 33342 staining based immunofluorescence assay
In Vitro	KDM5-C70 (10-9-10-5 M; 7 天; MM.1S 骨髓瘤细胞) 处理在高浓度处理 7 天后显示出抗增殖作用[1]。			
	KDM5-C70 (50 μM; 7 天; MM.1S 骨髓瘤细胞) 处理可降低视网膜母细胞瘤蛋白 (Rb) 的磷酸化水平,同时保持磷酸化 Rb (pRb) 的总水平不变,表明细胞周期进程受损[1]。			
	染色质免疫沉淀及下一代测序表明,使用 KDM5-C70 时转录起始位点周围的 H3K4me3 水平增加,但使用 GSK467A 时变化不大 50 μM 抑制剂浓度[1]。			
	Cell Viability Assay[1]			
	Cell Line:	MM.1S myeloma cells		
	Concentration:	10 ⁻⁹ -10 ⁻⁵ M		
	Incubation Time:	7 days		
	Result:	Showed antiproliferative effects after 7 days of treatment at elevated concentrations.		
	Western Blot Analysis[1]			
	Cell Line:	MM.1S myeloma cells		
Concentration:	50 μM			
Incubation Time:	7 days			
Result:	Decreased the level of phosphorylation of retinoblastoma protein (Rb).			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (297.24 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	2.9724 mL	14.8619 mL	29.7239 mL
	5 mM	0.5945 mL	2.9724 mL	5.9448 mL
	10 mM	0.2972 mL	1.4862 mL	2.9724 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 (stored under nitrogen)。-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: ≥ 2.5 mg/mL (7.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
参考文献	[1]. Johansson C, et al. Structural analysis of human KDM5B guides histone demethylase inhibitor development. Nat Chem Biol. 2016 Jul;12(7):539-45. [2]. Blair LP, et al. KDM5 lysine demethylases are involved in maintenance of 3'UTR length. Sci Adv. 2016 Nov 18;2(11):e1501662.			



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 (stored under nitrogen)。-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	2.9724 mL	14.8619 mL	29.7239 mL	74.3097 mL
	5 mM	0.5945 mL	2.9724 mL	5.9448 mL	14.8619 mL
	10 mM	0.2972 mL	1.4862 mL	2.9724 mL	7.4310 mL
	15 mM	0.1982 mL	0.9908 mL	1.9816 mL	4.9540 mL
	20 mM	0.1486 mL	0.7431 mL	1.4862 mL	3.7155 mL
	25 mM	0.1189 mL	0.5945 mL	1.1890 mL	2.9724 mL
	30 mM	0.0991 mL	0.4954 mL	0.9908 mL	2.4770 mL
	40 mM	0.0743 mL	0.3715 mL	0.7431 mL	1.8577 mL
	50 mM	0.0594 mL	0.2972 mL	0.5945 mL	1.4862 mL
	60 mM	0.0495 mL	0.2477 mL	0.4954 mL	1.2385 mL
	80 mM	0.0372 mL	0.1858 mL	0.3715 mL	0.9289 mL
	100 mM	0.0297 mL	0.1486 mL	0.2972 mL	0.7431 mL