



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **EN4 MYC inhibitor**

CAS 号: **1197824-15-9**

产品货号: **S89228**

生物活性:

生物活性:

Description	EN4 是一种针对 MYC 的半胱氨酸 171 (C171) 的共价配体。EN4 对 c-MYC 的选择性高于 N-MYC 和 L-MYC。EN4 抑制 MYC 转录活性, 下调 MYC 靶标, 并具有抗肿瘤作用。				
In Vitro	EN4 (1-50 μM; 持续 72 小时) 处理以剂量依赖性方式显著损害 231MFP 乳腺癌细胞增殖, 在 50 μM 时增殖抑制 >90%[1]。				
	EN4 (50 μM; 持续 60 小时) 处理显著降低代表性 MYC 调节靶基因的蛋白质水平, 包括 CDK2 和 CDC25A。EN4 处理还显著降低了 MYC 水平[1]。				
	EN4 对 MYC/MAX 与其 DNA 共有序列的体外结合以及细胞内 MYC 转录活性的抑制作用最强。EN4 以剂量响应方式抑制 MYC/MAX 与 E-box 响应元件 DNA 共有序列的结合, IC50 值为 6.7 μM。EN4 还以剂量响应方式抑制 MYC 荧光素酶报告基因活性, IC50 值为 2.8 μM[1]。				
	EN4 (50 μM; 持续 2 小时) 处理显著降低 MYC 热稳定性在 231MFP 乳腺癌细胞[1]。				
	Cell Proliferation Assay[1]				
	Cell Line:	231MFP breast cancer cells			
	Concentration:	1 μM, 10 μM, 50 μM			
	Incubation Time:	72 hours			
	Result:	Significantly impaired 231MFP breast cancer cell proliferation in a dose-dependent manner.			
	Western Blot Analysis[1]				
Cell Line:	231MFP breast cancer cells				
Concentration:	50 μM				
Incubation Time:	60 hours				
Result:	The protein levels of CDK2 and CDC25A were significantly lowered.				
In Vivo	EN4 (50 mg/kg; 腹腔注射; 每天; 持续 3 周) 处理显著减弱了 231MFP 乳腺肿瘤异种移植小鼠的肿瘤生长[1]。				
	Animal Model:	SCID mice injected with 231MFP breast cancer cells[1]			
	Dosage:	50 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; daily; for 3 weeks			
	Result:	Significantly attenuated tumor growth in vivo.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (300.14 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	2.4011 mL	12.0057 mL	24.0113 mL
		5 mM	0.4802 mL	2.4011 mL	4.8023 mL
10 mM		0.2401 mL	1.2006 mL	2.4011 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 (4.99 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 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 (4.99 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.99 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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。
参考文献	[1]. Lydia Boike, et al. Discovery of a Functional Covalent Ligand Targeting an Intrinsically Disordered Cysteine within MYC. Cell Chem Biol. 2021 Jan 21;28(1):4-13.e17.

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	2.4011 mL	12.0057 mL	24.0113 mL	60.0283 mL
	5 mM	0.4802 mL	2.4011 mL	4.8023 mL	12.0057 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	0.2401 mL	1.2006 mL	2.4011 mL	6.0028 mL
	15 mM	0.1601 mL	0.8004 mL	1.6008 mL	4.0019 mL
	20 mM	0.1201 mL	0.6003 mL	1.2006 mL	3.0014 mL
	25 mM	0.0960 mL	0.4802 mL	0.9605 mL	2.4011 mL
	30 mM	0.0800 mL	0.4002 mL	0.8004 mL	2.0009 mL
	40 mM	0.0600 mL	0.3001 mL	0.6003 mL	1.5007 mL
	50 mM	0.0480 mL	0.2401 mL	0.4802 mL	1.2006 mL
	60 mM	0.0400 mL	0.2001 mL	0.4002 mL	1.0005 mL
	80 mM	0.0300 mL	0.1501 mL	0.3001 mL	0.7504 mL
	100 mM	0.0240 mL	0.1201 mL	0.2401 mL	0.6003 mL



源叶