



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: δ -Secretase inhibitor 11

CAS 号: 842964-18-5

产品货号: S89631

生物活性:					
Description	δ -Secretase inhibitor 11 (compound 11) 是一种口服有效、可透过血脑屏障的、无毒、选择性和特异性的 δ -secretase 抑制剂, 其 IC50 为 0.7 μ M。 δ -Secretase inhibitor 11 与 δ -Secretase 的活性位点和变构位点相互作用。 δ -Secretase inhibitor 11 可衰减 tau 和 APP (淀粉样前体蛋白)的裂解。 δ -Secretase inhibitor 11 可改善 tau P301S 和 5XFAD 转基因小鼠模型的突触功能障碍和认知功能障碍。 δ -Secretase inhibitor 11 可用于阿尔茨海默病的研究。				
IC50 & Target	Caspase-3 31.86 $\pm$ 1. μ M (IC50)	Caspase-8 86.71 $\pm$ 10 μ M (IC50)			
In Vitro	δ -分泌酶抑制剂 11 (化合物 11) (0-1 μ M, 10 分钟) 以浓度和时间依赖性方式抑制 δ -分泌酶[1]。 δ -分泌酶抑制剂 11 (0-1 μ M) 通过 δ -分泌酶[1] 选择性地阻断 tau 和 APP (淀粉样前体蛋白) 片段化.				
In Vivo	δ -Secretase inhibitor 11 (化合物 11) (10 mg/kg, 口服, 每天一次, 持续 3 个月) 减轻 OGD (氧糖剥夺) 诱导的神经元损伤, 并特别发挥神经保护作用[1]。				
	δ -Secretase inhibitor 11 (0-10 mg/kg, 口服, 每天一次, 持续 1.5 个月和 3 个月) 抑制 δ -分泌酶活性, 减轻 5XFAD 小鼠模型中的 A β 沉积和认知缺陷[1]。				
	Animal Model:	Tau P301S transgenic mice (n=4 mice per group)[1]			
	Dosage:	10 mg/kg			
	Administration:	Orally, once daily for 3 months			
	Result:	Significantly inhibited the activity of δ -secretase in both wild-type and tau P301S mice brain, increased PP2A activity, and attenuated the truncation and phosphorylation of tau in tau P301S mice. Ameliorated synaptic loss and restored synaptic dysfunction in tau P301S mice.			
	Animal Model:	5XFAD mice[1]			
	Dosage:	2, 5 or 10 mg kg			
	Administration:	Orally, once daily for 1.5 and 3 months			
	Result:	Attenuated the β -secretase-mediated processing of APP, significantly decreased the concentrations of A β 1-40 and A β 1-42 in the brain lysates, and attenuated A β deposition in a time- and dose-dependent manner.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 116.67 mg/mL (529.76 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	4.5407 mL	22.7033 mL	45.4067 mL
		5 mM	0.9081 mL	4.5407 mL	9.0813 mL
	10 mM	0.4541 mL	2.2703 mL	4.5407 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。
参考文献	[1]. Zhang Z, et al. Inhibition of delta-secretase improves cognitive functions in mouse models of Alzheimer's disease. Nat Commun. 2017 Mar 27;8:14740.

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	4.5407 mL	22.7033 mL	45.4067 mL	113.5167 mL
	5 mM	0.9081 mL	4.5407 mL	9.0813 mL	22.7033 mL
	10 mM	0.4541 mL	2.2703 mL	4.5407 mL	11.3517 mL
	15 mM	0.3027 mL	1.5136 mL	3.0271 mL	7.5678 mL
	20 mM	0.2270 mL	1.1352 mL	2.2703 mL	5.6758 mL
	25 mM	0.1816 mL	0.9081 mL	1.8163 mL	4.5407 mL
	30 mM	0.1514 mL	0.7568 mL	1.5136 mL	3.7839 mL
	40 mM	0.1135 mL	0.5676 mL	1.1352 mL	2.8379 mL
	50 mM	0.0908 mL	0.4541 mL	0.9081 mL	2.2703 mL
	60 mM	0.0757 mL	0.3784 mL	0.7568 mL	1.8919 mL
	80 mM	0.0568 mL	0.2838 mL	0.5676 mL	1.4190 mL
	100 mM	0.0454 mL	0.2270 mL	0.4541 mL	1.1352 mL