



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: **WSB1 Degradar 1**

CAS 号: **2306039-66-5**

产品货号: **S89827**

生物活性:																					
Description		WSB1 Degradar 1 is a poten and orally active WSB1 (WD repeat and SOCS box-containing 1) degrader. WSB1 Degradar 1 has anticancer metastatic effects[1].																			
In Vitro		WSB1 降解剂 1 (化合物 4; 0.25-2500 nM; 2-24 小时; H1299-WSB1 细胞) 处理以时间依赖性和剂量依赖性方式诱导 WSB1 降解[1]。 WSB1 Degradar 1 (化合物 4) 在 KHOS 和 H460 细胞系中表现出有效的抗迁移功效, IC50 值分别为 39.1 μM 和 24.47 μM[1]。 WSB1 Degradar 1 (化合物 4) 显著抑制 KHOS 细胞在常氧和缺氧条件下的癌细胞迁移。WSB1 降解剂 1 (5 μM) 处理可提高缺氧条件下 KHOS 细胞中 RhoGDI2 蛋白的水平[1]。 H1299-WSB1 细胞的伤口愈合被显著抑制 WSB1 Degradar 1. WSB1 Degradar 1 只能阻断野生型 A2780 (A2780-WT) 细胞的伤口愈合能力, 但不能阻断 A2780-WSB1/KO 细胞[1]。 Western Blot Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>H1299-WSB1 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>0.25 nM, 2.5 nM, 25 nM, 250 nM, 2500 nM</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>2 hours, 4 hours, 6 hours, 8 hours, 12 hours, 24 hours</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Induced WSB1 degradation in time-dependent and dose-dependent manners.</td></tr></table>			Cell Line:	H1299-WSB1 cells	Concentration:	0.25 nM, 2.5 nM, 25 nM, 250 nM, 2500 nM	Incubation Time:	2 hours, 4 hours, 6 hours, 8 hours, 12 hours, 24 hours	Result:	Induced WSB1 degradation in time-dependent and dose-dependent manners.									
Cell Line:	H1299-WSB1 cells																				
Concentration:	0.25 nM, 2.5 nM, 25 nM, 250 nM, 2500 nM																				
Incubation Time:	2 hours, 4 hours, 6 hours, 8 hours, 12 hours, 24 hours																				
Result:	Induced WSB1 degradation in time-dependent and dose-dependent manners.																				
In Vivo		WSB1 Degradar 1 (化合物 4; 100 mg/kg; 口服每天; 连续 28 天) 处理可有效抑制癌细胞的肺转移[1]。在大鼠中, 经过 100 mg/kg 口服给药或 160mg/kg 腹腔给药 WSB1 Degradar 1 (化合物 4), 两种给药方式均观察到快速吸收 (Tmax), 但前一种给药显示出快速清除 (T1/2) 此外, WSB1 降解剂 1 在口服或腹腔给药组的 Cmax 和 AUC0-t 值显示可接受的血液暴露[1]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Balb/c (nu/nu) mice bearing highly metastatic 4T1 breast cancer cells[1].</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>100 mg/kg/day</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>p.o.; daily; for 28 days</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Effectively inhibited the pulmonary metastasis of cancer cells.</td></tr></table>			Animal Model:	Balb/c (nu/nu) mice bearing highly metastatic 4T1 breast cancer cells[1].	Dosage:	100 mg/kg/day	Administration:	p.o.; daily; for 28 days	Result:	Effectively inhibited the pulmonary metastasis of cancer cells.									
Animal Model:	Balb/c (nu/nu) mice bearing highly metastatic 4T1 breast cancer cells[1].																				
Dosage:	100 mg/kg/day																				
Administration:	p.o.; daily; for 28 days																				
Result:	Effectively inhibited the pulmonary metastasis of cancer cells.																				
Solvent&Solubility		细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (74.76 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) <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent / Mass / Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.9903 mL</td><td>14.9517 mL</td><td>29.9034 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.5981 mL</td><td>2.9903 mL</td><td>5.9807 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2990 mL</td><td>1.4952 mL</td><td>2.9903 mL</td></tr></table> * 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。 -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:			Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.9903 mL	14.9517 mL	29.9034 mL	5 mM	0.5981 mL	2.9903 mL	5.9807 mL	10 mM	0.2990 mL	1.4952 mL	2.9903 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																	
	1 mM	2.9903 mL	14.9517 mL	29.9034 mL																	
	5 mM	0.5981 mL	2.9903 mL	5.9807 mL																	
	10 mM	0.2990 mL	1.4952 mL	2.9903 mL																	



	——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 (6.22 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]. Jinxin Che, et al. Discovery of 5,6-Bis(4-methoxy-3-methylphenyl)pyridin-2-amine as a WSB1 Degradator to Inhibit Cancer Cell Metastasis. J Med Chem. 2021 Jun 1.

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。-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	2.9903 mL	14.9517 mL	29.9034 mL	74.7585 mL
	5 mM	0.5981 mL	2.9903 mL	5.9807 mL	14.9517 mL
	10 mM	0.2990 mL	1.4952 mL	2.9903 mL	7.4759 mL
	15 mM	0.1994 mL	0.9968 mL	1.9936 mL	4.9839 mL
	20 mM	0.1495 mL	0.7476 mL	1.4952 mL	3.7379 mL
	25 mM	0.1196 mL	0.5981 mL	1.1961 mL	2.9903 mL
	30 mM	0.0997 mL	0.4984 mL	0.9968 mL	2.4920 mL
	40 mM	0.0748 mL	0.3738 mL	0.7476 mL	1.8690 mL
	50 mM	0.0598 mL	0.2990 mL	0.5981 mL	1.4952 mL
	60 mM	0.0498 mL	0.2492 mL	0.4984 mL	1.2460 mL