



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: **A-485**
CAS 号: **1889279-16-6**
产品货号: **Y68710**

生物活性:

Description	A-485, a chemical probe, is a potent and selective catalytic inhibitor of p300/CBP with IC50s of 9.8 nM and 2.6 nM for p300 and CBP histone acetyltransferase (HAT), respectively[1].			
IC50 & Target	CBP/p300			
In Vitro	用 A-485 对前列腺腺癌 PC-3 细胞进行三小时治疗会导致 H3K27Ac 剂量依赖性下降, 半数最大有效浓度 (EC50) 为 73 nM。用 A-485 治疗不会改变 p300 或 CBP 蛋白水平。 在血液肿瘤中观察到最广泛的敏感性, 其中 A-485 在大多数多发性骨髓瘤细胞系以及部分急性髓系白血病细胞系和非霍奇金淋巴瘤细胞系中表现出强效活性。A-485 在所有五种前列腺癌细胞系中诱导 H3K27Ac 相应下降[1]。			
In Vivo	在 SCID 雄性小鼠体内形成肿瘤后, 每天腹腔内注射两次 A-485, 在给药 21 天后可抑制 54% 的肿瘤生长。此外, 在患有肿瘤的动物中, 给药七天的 A-485 可在给药后三小时诱导 MYC 和 AR 依赖性基因 SLC45A3 的 mRNA 水平下降, 并且(对于 MYC)蛋白质水平下降, 这表明 A-485 可抑制 p300 介导的转录活性。然而, 在第七天给药后 16 小时, 与 3 小时相比, 血浆和肿瘤中的 A-485 药物水平有所下降。A-485 可导致动物体重减轻 9%, 完成 A-485 给药方案后动物会迅速恢复[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (186.40 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
		1 mM	1.8640 mL	9.3200 mL
		5 mM	0.3728 mL	1.8640 mL
		10 mM	0.1864 mL	0.9320 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。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: 11 mg/mL (20.50 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.88 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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (3.88 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。 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 四 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (3.88 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]. Lasko LM, et al. Discovery of a selective catalytic p300/CBP inhibitor that targets lineage-specific tumours. Nature. 2017 Oct 5;550(7674):128-132.

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。-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	1 mM	1.8640 mL	9.3200 mL	18.6400 mL	46.6001 mL
	5 mM	0.3728 mL	1.8640 mL	3.7280 mL	9.3200 mL
	10 mM	0.1864 mL	0.9320 mL	1.8640 mL	4.6600 mL
	15 mM	0.1243 mL	0.6213 mL	1.2427 mL	3.1067 mL
	20 mM	0.0932 mL	0.4660 mL	0.9320 mL	2.3300 mL
	25 mM	0.0746 mL	0.3728 mL	0.7456 mL	1.8640 mL
	30 mM	0.0621 mL	0.3107 mL	0.6213 mL	1.5533 mL
	40 mM	0.0466 mL	0.2330 mL	0.4660 mL	1.1650 mL
	50 mM	0.0373 mL	0.1864 mL	0.3728 mL	0.9320 mL
	60 mM	0.0311 mL	0.1553 mL	0.3107 mL	0.7767 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

	80 mM	0.0233 mL	0.1165 mL	0.2330 mL	0.5825 mL
	100 mM	0.0186 mL	0.0932 mL	0.1864 mL	0.4660 mL



源叶