

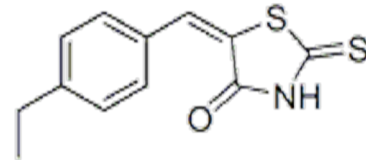
10058-F4 (c-Myc抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6650-10mM	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6650-5mg	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	5mg
SC6650-25mg	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(5E)-5-[(4-ethylphenyl)methylidene]-2-sulfanylidene-1,3-thiazolidin-4-one
简称	10058-F4
别名	c-Myc Inhibitor
中文名	N/A
化学式	C ₁₂ H ₁₁ NOS ₂
分子量	249.35
CAS号	403811-55-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 50mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入2.01ml DMSO, 或每2.49mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6650-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	10058-F4是一种c-Myc抑制剂, 特异性抑制c-Myc-Max相互作用, 且阻止c-Myc靶基因表达的转录激活。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	c-Myc	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	10058-F4抑制白血病细胞生长, 且抑制Myc和Max二聚化。10058-F4诱导Aml细胞的细胞周期停滞和凋亡。10058-F4使Aml细胞停滞在G0/G1期, 下调c-Myc的表达, 上调CDK抑制剂p21和p27。同时, 10058-F4通过激活线粒体途径诱导细胞凋亡, 观察到Bcl-2下调, Bax上调, 胞浆内细胞色素C释放, 及caspase3、7和9裂解。此外, 10058-F4也诱导骨髓细胞分化, 可能通过激活多种转录因子。相似地, 10058-F4作用于原代Aml细胞, 诱导凋亡和分化。10058-F4降低c-Myc蛋白水平, 抑制HepG2细胞增殖, 可能通过上调细胞周期蛋白依赖性激酶(CDK)抑制剂、p21WAF1及降低细胞内[α]-甲胎蛋白(AFP)的水平。10058-F4处理, 还在转录水平下调人类端粒酶逆转录酶(hTERT)。10058-F4除了抑制HepG2细胞增殖, 还增强其对常规化疗药物、Doxorubicin、5-fluorouracil (5-FU)和Cisplatin的敏感性。				
体内研究	10058-F4单独静脉注射, 在5分钟时达到血浆峰值, 浓度约为300μM, 在360分钟时, 下降到低于检测下限。血药浓度-时间数据最好绘制成二室, 开放的, 线性模型。在脂肪, 对肺、肝、肾中发现10058-F4的最高组织浓度。10058-F4的肿瘤峰值浓度低于血浆峰值浓度至少十倍。在血浆, 肝和肾中确定10058-F4的8种代谢物。10058-F4的终端半衰期约为1小时, 分布容积为>200ml/kg。10058-F4按20或30mg/kg剂量静脉注射处理小鼠, 没有显著的肿瘤生长抑制作用。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	HL-60, U937和NB-4细胞
浓度	0, 30, 60, 90, 120, 150μM
处理时间	72小时

方法	细胞接种在96孔板上(细胞系按 10^5 /ml接种, 原代白血病细胞按 5×10^5 /ml接种), 按一式三份使用指定浓度10058-F4处理。在不同时间点, 每孔加入20 μ l 5mg/ml MTT。在37°C下温育3小时后, 移除MTT培养基, 加入100 μ l DMSO 裂解缓冲液。使用分光光度计测定570nm波长处, 处理组细胞与溶剂对照组细胞的吸光度百分比, 测测评活细胞数。
----	---

动物实验	
动物模型	携带PC-3和DU145移植瘤的SCID小鼠
配制	N/A
剂量	20或30mg/kg
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

- 1.Huang MJ, et al. Exp Hematol, 2006, 34(11), 1480-1489.
- 2.Lin CP, et al. Anticancer Drugs, 2007, 18(2), 161-170.
- 3.Guo J, et al. Cancer Chemother Pharmacol, 2009, 63(4), 615-625.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6650-10mM	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC6650-5mg	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	5mg
SC6650-25mg	10058-F4 (c-Myc抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01