

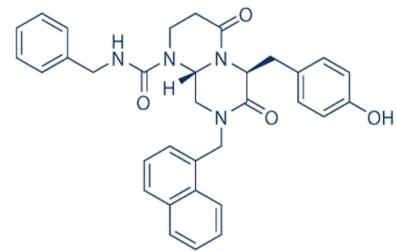
ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF6827-10mM	ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)	10mM×0.2ml
SF6827-5mg	ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)	5mg
SF6827-25mg	ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(6S,9aS)-N-benzyl-6-[(4-hydroxyphenyl)methyl]-8-(naphthalen-1-ylmethyl)-4,7-dioxo-3,6,9,9a-tetrahydro-2H-pyrazino[1,2-a]pyrimidine-1-carboxamide
简称	ICG001
别名	ICG-001, ICG 001
中文名	N/A
化学式	C ₃₃ H ₃₂ N ₄ O ₄
分子量	548.63
CAS号	847591-62-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 10mg/ml
溶液配制	5mg加入0.91ml DMSO, 或每5.49mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF6827-10mM用DMSO配制。



relative stereochemistry

➤ 生物信息:

产品描述	ICG-001拮抗Wnt/ β -catenin/TCF介导的转录, 并特异性结合到启动子结合蛋白(CBP), IC ₅₀ 为3 μ M, 但不能结合到相关的转录共激活因子p300上。				
信号通路	Stem Cells & Wnt; Cytoskeletal Signaling				
靶点	CBP	—	—	—	—
IC ₅₀	3 μ M	—	—	—	—
体外研究	ICG-001作用于TOPFLASH时, IC ₅₀ 为3 μ M, 而对含突变TCF位点的相关报告基因结构, FOPFLASH没有作用效果。使用25 μ M ICG-001处理SW480细胞8小时后, 降低Survivin和Cyclin D1 RNA和蛋白的稳定水平, 这两者都可通过 β -catenin上调。ICG-001作用于转化细胞而不是正常结肠细胞, 选择性诱导凋亡, 降低结肠癌细胞生长。ICG-001作用于presenilin-1突变细胞, 可表型营救正常神经生长因子(NGF)诱导的神经元分化和神经轴突生长, 强调TCF/ β -catenin信号通路在神经轴突生长和神经元分化中的重要性。最新研究显示5 μ M ICG-001作用于MCF7细胞, 抑制leptin诱导的EMT, 入侵和肿瘤干细胞球形成。				
体内研究	ICG-001水溶性类似物处理9周, 降低42%结肠和小肠息肉的形成和非甾体类抗炎试剂Sulindac效果类似, Sulindac是一贯治疗这种疾病模型的药物。在整个的处理期间观察不到明显的毒性。类似物按150mg/kg剂量静脉注射处理SW620裸鼠肿瘤衰退移植瘤模型, 处理19天, 显著降低肿瘤体积, 没有死亡, 体重也没有降低。ICG-001每天按5mg/kg剂量处理小鼠, 显著抑制beta-catenin信号, 且降低Bleomycin诱导的肺纤维化, 同时保护上皮细胞。				
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	双重-荧光素酶报告基因实验系统提供形成双重报告基因实验的有效方法。在DLR™实验中, 顺序测量萤火虫型和花虫型荧光素酶活性。加入荧光素酶实验试剂 II (LAR II), 获得“辉光型”发光信号, 测量萤火虫型荧光素酶报告基因。定量测量萤火虫荧光素酶后, 淬灭反应, 同时在相同试管中加入Stop & Glo®试剂开始花虫型荧光素酶反应。通过花型荧光素酶, Stop & Glo®试剂也产生“辉光型”信号, 在测量过程中缓慢降解。在DLR™实验系统中, 两种报告基因都使用亚原子(<10-18)敏感性进行线性分析, 在实验宿主细胞中都没有内在活性。而且, DLR™实验的集成格式可以在转化细胞或无细胞转录/翻译反

应中快速测量报告基因。

细胞实验	
细胞系	Human colon carcinoma cell lines SW480, SW620, and HCT116, normal colonic epithelial cell line CCD-841Co
浓度	~25 μ M
处理时间	24 hours
方法	1. Prior to starting the assay, prepare the Apo-ONE Caspase-3/7 Reagent, and mix thoroughly. 2. For best results, empirical determination of the optimal cell number, apoptosis induction treatment and incubation period for the cell culture system may be necessary. 3. Use identical cell numbers and volumes for the assay and the negative control samples. 4. Do not mix Apo-ONE Caspase-3/7 Reagent and samples by manual pipetting. Mixing in this manner is unnecessary and may create bubbles that interfere with fluorescence readings or cross-contaminate the samples. Gentle mixing may be performed using a plate shaker. 5. Total incubation time for the assay depends upon the amount of caspase- 3/7 present in the sample. 6. The Apo-ONE Caspase-3/7 Reagent is formulated to mediate cellular lysis and support optimal caspase-3/7 activity. In rare instances, the reagent does not affect complete lysis of cultured cells. In such cases, lysis is enhanced by a freeze-thaw cycle. For best results, freeze at -70°C, then thaw at room temperature. After equilibration, mix to homogeneity and incubate until measurable fluorescence is achieved.

动物实验	
动物模型	7周大的雄性C57BL/6J-Apc Min/+小鼠
配制	使用ICG-001水溶性类似物
剂量	300mg/kg
给药方式	ICG-001水溶性类似物每天口服处理，持续9周

参考文献:

- 1.Emami KH, et al, Proc Natl Acad Sci USA, 2004, 101(34), 12682-12687.
- 2.Teo JL, et al, Proc Natl Acad Sci USA, 2005, 102(34), 12171-12176.
- 3.Yan D, et al, J Biol Chem, 2012, 287(11), 8598-8612.
- 4.Henderson WR Jr, et al, Proc Natl Acad Sci USA, 2010, 107(32), 14309-14314.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF6827-10mM	ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SF6827-5mg	ICG001 (Wnt/ β -catenin抑制剂)	5mg
SF6827-25mg	ICG001 (Wnt/ β -catenin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成高浓度的储备液(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