

HB211216

XAV-939(NVP-XAV939, XAV939)

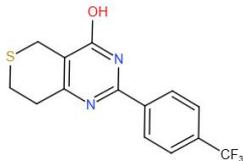
产品信息

产品名称	产品编号	规格
XAV-939(NVP-XAV939, XAV939)	52904ES10	10 mg
	52904ES25	25 mg

产品描述

XAV-939 是一个强效且具细胞渗透性的小分子抑制剂，选择性抑制 tankyrase 活性从而抑制 Wnt/ β -catenin 信号通路介导的转录，抑制多聚 ADP 核糖基化酶 TNKS1 和 TNKS2，其 IC₅₀ 值分别是 11 nM 和 4 nM。Wnt/ β -catenin 通路在胚胎分化和组织再生过程中发挥着重要作用，因此 XAV-939 是用来研究体外干细胞分化和探索各种培养体系下干细胞再生潜能的重要工具。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	939;3,5,7,8-Tetrahydro-2-[4-(trifluoromethyl)phenyl]-4H-thiopyrano[4,3-d]pyrimidin-4-one; XAV939; NVP-XAV939
中文名称 (Chinese Name)	3,5,7,8-四氢-2-[4-(三氟甲基)苯基]-4H-噻喃并[4,3-D]嘧啶-4-酮
靶点 (Target)	TNKS1; TNKS2
CAS 号 (CAS NO.)	284028-89-3
分子式 (Formula)	C ₁₄ H ₁₁ F ₃ N ₂ OS
分子量 (Molecular Weight)	312.31
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C，有效期 2 年。建议分装后-20°C避光保存，避免反复冻融。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

XAV-939 能与重组 PARP1 结合，但结合亲和力明显降低($K_d=1.2 \mu\text{M}$)。XAV939 ($1 \mu\text{M}$)能强烈抑制 SW480 细胞的 STF 活性和 Wnt3a 刺激的 HEK293 细胞的 STF 活性，但不影响 CRE、NF- κ B 和 TGF- β 荧光素酶报告因子。XAV-939 通过抑制 HEK293 细胞中 tankyase 活性调控轴蛋白表达水平。^[1] 与 DMSO 对照组相比，XAV939 ($0.5 \mu\text{M}$, $1.0 \mu\text{M}$)可降低人淋巴细胞中 50%的 DNA-PKcs 蛋白表达水平。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

XAV939 (2.5 mg/kg , 腹膜内注射) 处理小鼠，每天四次，与对照组相比，经 XAV939 处理的小鼠减少 50%的真皮增厚，羟脯氨酸含量和肌成纤维细胞的数量也显著降低。^[3]

参考文献

- [1]. Huang SM, et al. Tankyrase inhibition stabilizes axin and antagonizes Wnt signalling. Nature. 2009 Oct 1;461(7264):614-620.
- [2]. Dregalla RC, et al. Regulatory roles of tankyrase 1 at telomeres and in DNA repair: suppression of T-SCE and stabilization of DNA-PKcs. Aging (Albany NY). 2010 Oct;2(10):691-708.
- [3] Distler A, et al. Inactivation of tankyrases reduces experimental fibrosis by inhibiting canonical Wntsignalling. Annals of the rheumatic diseases, 2013, 72(9): 1575-1580.