

Longdaysin

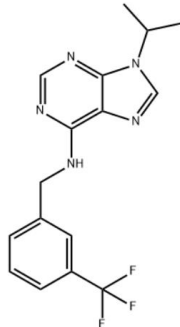
产品信息

产品名称	产品编号	规格
Longdaysin	52944ES08	5 mg
	52944ES10	10 mg

产品描述

Longdaysin 是一种特异性的 Wnt/ β -catenin 信号通路的抑制剂, Casein Kinase 抑制剂, 酪蛋白激酶抑制剂, 能显著降低 β -catenin 的表达水平, 抑制 Wnt/ β -catenin 信号通路, 通过阻断 CK1 δ/ϵ 和 Wnt 信号通路发挥抗肿瘤作用。Longdaysin 是 CK1 α 、CK1 δ 、CDK7 和 ERK2 的抑制剂, 其 IC₅₀ 值分别为 5.6 μ M、8.8 μ M、29 μ M 和 52 μ M, 但不影响 p38 α 的活性。Longdaysin 抑制肿瘤细胞的生长增值, 具体良好的抗肿瘤作用, 在生物钟调节方面也有一定的作用。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	9-isopropyl-N-(3-(trifluoromethyl)benzyl)-9H-purin-6-amine
靶点 (Target)	CK1 α ; CK1 δ ; CDK7; ERK2
CAS 号 (CAS NO.)	1353867-91-0
分子式 (Formula)	C ₁₆ H ₁₆ F ₃ N ₅
分子量 (Molecular Weight)	335.33
外观 (Appearance)	固体粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO: ≥10 mg/mL
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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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）

为了研究 Longdaysin 的抗癌活性和机制,使用 1-50 μM Longdaysin 处理转染的 HEK293T 细胞 7 天或 10 天,Western blot 分析显示 Longdaysin 通过作用 Wnt1, LRP6, DVL2, CK1 δ , CK1 ϵ , CK1 δ /LRP6 等上游分子抑制 Wnt/ β -catenin 信号通路。为了检测 Longdaysin 对 Wnt/ β -catenin 信号通路的影响,接种 10^3 个的乳腺癌细胞系 Hs578T 和 MDA-MB-231 至 6 孔培养板中,添加不同浓度 (10, 25 μM) Longdaysin 工作液,并孵育细胞 7 天。经实验验证, Longdaysin 以剂量依赖性的方式抑制克隆形成。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

为了检测 Longdaysin 抗肿瘤的潜在作用, 1×10^7 个 MDA-MB-231 细胞皮下注射到雌性 Balb/c *nu/nu* 小鼠,待成瘤后,给予连续 3 周,每 3 天一次 5 mg/kg 体重的 Longdaysin,与未给予 Longdaysin 对照组相比,在不影响动物体重的情况下,测量的肿瘤体积和重量均显著变小,发现 Longdaysin 抑制肿瘤细胞的增值,但不影响小鼠体重,毒性很低。将 MDA-MB-231 细胞通过皮下注射到裸鼠体内 (每只小鼠 1×10^7 个细胞),每 3 天观察和测量一次肿瘤的生长。当肿瘤达到约 50 mm³ 时,将小鼠随机分为两组 (每组八只小鼠),每三天注射一次药物 (0.8% DMSO, 12% Cremophor, 8% 乙醇的生理盐水) 或 5 mg/kg Longdaysin 药物,随后用卡尺测量肿瘤体积。注射药物 3 周后,处死小鼠,收集肿瘤组织并称重,然后固定在福尔马林缓冲液中。发现在 MDA-MB-231 乳腺癌异种移植瘤中,用 Longdaysin 处理小鼠,可抑制肿瘤生长并抑制 Wnt/ β -catenin 信号传导,荧光定量 PCR 显示 Longdaysin 显著降低 β -catenin 的表达水平。^[1]

参考文献

[1]. Xiong Y, et al. Longdaysin inhibits Wnt/ β -catenin signaling and exhibits antitumor activity against breast cancer. *Onco Targets Ther.* 2019 Feb 5;12: 993-1005.