

## Tegatrabetan (BC2059)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Tegatrabetan (BC2059)	53335ES08	5 mg
	53335ES10	10 mg

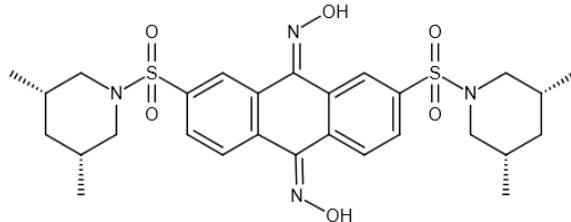
### 产品描述

Tegatrabetan (BC2059, BC-2059, BC 2059, Tegavivint)是  $\beta$ -Catenin 拮抗剂。Tegatrabetan 破坏  $\beta$ -catenin 与 scaffold protein transducin  $\beta$ -like 1 (TBL1)的结合, 抑制蛋白酶体降解, 下调  $\beta$ -catenin 胞核表达水平。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	BC2059, BC-2059, BC 2059, Tegavivint
中文名称 (Chinese Name)	rel-2,7-双(((3R,5S)-3,5-二甲基哌啶-1-基)磺酰基)蒽-9,10-二酮二肟
靶点 (Target)	$\beta$ -Catenin
通路 (Pathway)	Stem Cell/Wnt-- $\beta$ -Catenin
CAS 号 (CAS NO.)	1227637-23-1
分子式 (Formula)	C <sub>28</sub> H <sub>36</sub> N <sub>4</sub> O <sub>6</sub> S <sub>2</sub>
分子量 (Molecular Weight)	588.74
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO, 溶于水

### 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 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 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)

WNT- $\beta$ -catenin 通路对急性髓系白血病(AML)干/母细胞祖细胞(BPCs)的自我更新、生长和存活至关重要。调控的 WNT 信号抑制  $\beta$ -catenin 的降解, 可使 AML-BPCs 中  $\beta$ -catenin 与转录调节因子 T 细胞因子(TCF)4/淋巴增强子因子 1 的核易位和辅因子活性增加。BC2059 (20-100 nM; 48 小时) 抑制悬浮培养 120 小时以上的细胞增殖, 并剂量依赖性地诱导培养的人急性髓系细胞白血病(AML)HL-60、OCI-AML3 和 MV4-11 细胞凋亡。BC2059 (20 nM, 50 nM; 24 小时) 在 G0/G1 期诱导适度但显著的细胞聚集, 伴随细胞周期 G2/M 期的下降。BC2059 (100 nM, 24 小时) 在不影响 OCI-AML3、HL-60 和 MV4-11 细胞中 TBL1 水平的情况下, 耗尽  $\beta$ -连环蛋白及其靶基因 (包括 c-MYC 和 survivin) 的水平。<sup>[1]</sup>

### (二) 动物实验 (体内实验)

Tegatrabetan (1.0 或 5.0 mg/kg/d; 静脉注射) 显著提高小鼠的中位生存期约 17.5 天至 39 天。Treatment 配合 Tegatrabetan 治疗 (10 mg/kg/d; 单独静脉注射) 进一步提高中位生存期至 51.5 天。BC 治疗显著提高了移植有培养或原代 AML-BPCs 的免疫衰竭小鼠的中位生存率, 表现出  $\beta$ -catenin 的核表达。泛组蛋白去乙酰化酶抑制剂 panobinostat 和 BC 协同诱导培养和原代 AML-BPCs 凋亡, 显著提高了移植原代 AML-BPCs 的免疫衰竭小鼠的存活率。<sup>[1]</sup>

### 参考文献

[1] Fiskus W, et al. Pre-clinical efficacy of combined therapy with novel  $\beta$ -catenin antagonist BC2059 and histone deacetylase inhibitor against AML cells. *Leukemia*. 2015 Jun;29(6):1267-78.