产品名称：**YK-4-279**
产品别名： **CS-0667**

生物活性：

Description

YK 4-279 is an inhibitor of RNA Helicase A (RHA) binding to the oncogenic transciption factor EWS-FLI1. YK-4-279 inhibits Ewing's sarcoma family tumor (ESFT) cell growth; YK-4-279 induces apoptosis. IC50 value: Target: RNA Helicase A ES-FLI1 is an oncogenic fusion protein found in Ewing's sarcoma, a family of undifferentiated tumors that occur throughout the body. The binding of RNA helicase A (RHA) to ES-FLI1 promotes its oncogenic function. YK-4-279 is an inhibitor of protein-protein interactions between ES-FLI1 and RHA. At 10 μM, YK-4-279 blocks RHA binding to ES-FLI1 and induces apoptosis of a panel of Ewing's sarcoma tumor cell lines with IC50 values ranging from 0.5-2 μM. At 1.5 mg per dose, YK-4-279 reduces the growth of Ewing's sarcoma orthotopic xenografts in mice after treatment with the inhibitor for two weeks.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 25 mg/mL (**68.27 mM;** Need ultrasonic)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.7307 mL	13.6537 mL	27.3075 mL
	5 mM	0.5461 mL	2.7307 mL	5.4615 mL
	10 mM	0.2731 mL	1.3654 mL	2.7307 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

In Vivo:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 **In Vitro** 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。

3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM); Clear solution

	此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.83 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Barber-Rotenberg JS, et al. Single enantiomer of YK-4-279 demonstrates specificity in targeting the oncogene EWS-FLI1. Oncotarget. 2012 Feb;3(2):172-82. [2]. Rahim S, et al. YK-4-279 inhibits ERG and ETV1 mediated prostate cancer cell invasion. PLoS One. 2011 Apr 29;6(4):e19343. [3]. Erkizan HV, et al. A small molecule blocking oncogenic protein EWS-FLI1 interaction with RNA helicase A inhibits growth of Ewing's sarcoma. Nat Med. 2009 Jul;15(7):750-6.