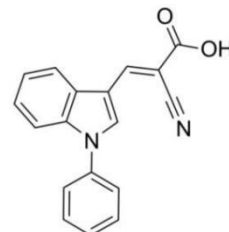


UK-5099; PF-1005023
基本信息

Cat.No.:	UM0601A	5mg
	UM0601B	50mg
	UM0601C	200mg
质量标准:	> 99%,BR	
CAS No.:	56396-35-1	
分子式:	C ₁₈ H ₁₂ N ₂ O ₂	
分子量:	288.30	
别名:	2-氰基-3-(1-苯基-1H-吡啶-3-基)-2-丙烯酸; UK5099; UK 5099; PF1005023; PF 1005023	
作用通路:	Metabolic Enzyme/Protease	
作用靶点:	Mitochondrial Metabolism	
外观:	黄色固体	
澄清度:	DMSO 中澄清, 无杂质	
有机溶剂残留:	符合 ICH 及中国药典规定	
储存条件:	-20°C, 避光防潮密闭干燥	
运输条件:	湿冰运输 (按季节)	


溶解性数据

体外实验	溶解性(25°C): DMSO、DMF: > 35mg/ml; 甲醇、乙醇、水中难溶解				
	制备储备液	浓度 溶剂体积 质量	1mg	5mg	10mg
		1mM	3.4686 mL	17.3430 mL	34.6861 mL
		5mM	0.6937 mL	3.4686 mL	6.9372 mL
		10mM	0.3469 mL	1.7343 mL	3.4686 mL
	*请参考溶解度信息来选择合适的溶剂配制储备液。配成溶液后, 请分装保存, 避免反复冻融。 *Purescix 内部测试了所有化合物的溶解度, 若实际溶解度与公布的值略有不同为正常现象, 是由于批次之间的轻微差异造成的, 请适当调整之后使用。				

体内实验 (现用现配)	10%DMSO→ 40%PEG300→ 5%Tween-80 → 45%Saline 此方案可获得≥2.5mg/ml (8.67mM) 的澄清溶液	以 1mL 工作液为例, 取 100μL 25mg/ml 的澄清 DMSO 储备液加到 400μL PEG300 中, 混合均匀; 向上述体系中加入 50μL Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450μL 生理盐水定容至 1mL。
	10%DMSO→ 90%玉米油 此方案可获得≥2.5mg/ml (8.67mM) 的澄清溶液	以 1mL 工作液为例, 取 100μL 25mg/ml 的澄清 DMSO 储备液加到 900μL 玉米油中, 混合均匀。
	*以上溶解方案请先按照上述体外实验溶解数据配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂。 *以上溶剂前显示的百分比是指该溶剂在终溶液中的体积占比。 *以上溶解方案仅供参考, 您根据实验动物和给药方式进行适当的调整。 *体内实验的工作液, 建议现用现配, 当天使用。 *如果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。	

生物活性

【来源于公开文献, 仅供参考】

产品描述	UK-5099(PF-1005023)是线粒体丙酮酸转运蛋白(MPC)的有效抑制剂, 抑制丙酮酸依赖性 O ₂ 消耗的 IC ₅₀ 值为 50 nM。
IC ₅₀	MPC: IC ₅₀ : 50 nM ; Ki: 49 μM



体外研究 (In Vitro)	【来源于公开文献，仅供参考】 UK-5099(PF-1005023)是线粒体丙酮酸转运蛋白(MPC)的有效抑制剂，抑制丙酮酸依赖性 O₂ 消耗的 IC₅₀ 值为 50 nM^[1]。 UK-5099(PF-1005023)is a potent inhibitor of the mitochondrial pyruvate carrier,inhibiting pyruvate transport across the plasma membrane of trypanosomes with Ki value of 49μM^[2]。 UK-5099 还抑制单羧酸转运蛋白(MCT)^[3]。 UK-5099 以剂量依赖性方式显著抑制葡萄糖刺激的耗氧量增加，并且在 150μM 时将耗氧量降低到基础水平以下。UK5099 降低 832/13 细胞中的 ATP 水平并增加 ADP 和 AMP 水平^[4]。 UK-5099 抑制了 LnCap 细胞的增殖，UK5099 处理的细胞显示出显著更高比例的侧群分数，并表达更高水平的干性标记物 Oct3/4 和 Nanog。UK5099 应用可能是 Warburg 效应研究的理想模型^[5]。
体内研究 (In Vivo)	【来源于公开文献，仅供参考】 UK-5099 (32μmol/kg；单次腹腔注射；C57BLK 小鼠) 30、60 和 120 min 时引起显著更大的葡萄糖漂移。UK-5099 也显著增加了曲线下面积。这些研究表明 MPC 在体内调节葡萄糖耐量方面发挥着重要作用^[4]。

实验方法

【来源于公开文献，仅供参考】

	细胞系	实验类型	给药浓度	孵育时间	活性描述	PubMed
体外实验	832/13 cell line	Function assay	10-150 μM	2h	UK5099 dose-dependently inhibit glucose-stimulated insulin secretion in 832/13 cells	4036342
	LnCap	Cell viability assay	10 μM	1-5d	UK5099 suppressed proliferation and arrested cell cycle at G1/G0	4741963
	IPI-2I	Function assay	5 & 10 μM	12h	UK5099 inhibited PDCoV proliferation, indicating that mitochondrial pyruvic acid catabolism has a beneficial effect on PDCoV infection.	38461791

体内实验 (现用现配)	动物种类	给药剂量	给药方式	结果
	C57BLK mice	32 μmol/kg	intraperitoneal injection	caused a significantly greater glucose excursion at 30, 60, and 120 min as compared with DMSO control mice

注意事项

1. 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理（如 0.22μm 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
2. 溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。
3. 科研试剂，严禁用于人体和临床。
4. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
5. 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

参考文献

- [1]. Halestrap AP. The mitochondrial pyruvate carrier. Kinetics and specificity for substrates and inhibitors. Biochem J. 1975 April; 148(1): 85-96.
- [2]. Wiemer EA, Michels PA, Opperdoes FR. The inhibition of pyruvate transport across the plasma membrane of the bloodstream form of Trypanosoma brucei and its metabolic implications. Biochem J. 1995 Dec 1;312 (Pt 2)(Pt 2):479-84. doi: 10.1042/bj3120479. PMID: 8526859; PMCID: PMC1136287.
- [3]. Hinoi E, et al. A molecular mechanism of pyruvate protection against cytotoxicity of reactive oxygen species in osteoblasts. Mol Pharmacol. 2006 Sep;70(3):925-35. Epub 2006 Jun 9.
- [4]. Patterson JN, et al. Mitochondrial metabolism of pyruvate is essential for regulating glucose-stimulated secretion. J Biol Chem. 2014 May 9;289(19):13335-46.
- [5]. Zhong Y, et al. Application of mitochondrial pyruvate carrier blocker UK5099 creates metabolic reprogram and greater stem-like properties in LnCap prostate cancer cells in vitro. Oncotarget. 2015 Nov 10;6(35):37758-69.
- [6]. Wiemer EA, Michels PA, Opperdoes FR. The inhibition of pyruvate transport across the plasma membrane of the bloodstream form of Trypanosoma brucei and its metabolic implications. Biochem J. 1995 Dec 1;312 (Pt 2)(Pt 2):479-84.
- [7]. Su G, Liu J, Duan C, Fang P, Fang L, Zhou Y, Xiao S. Enteric coronavirus PDCoV evokes a non-Warburg effect by hijacking pyruvic acid as a metabolic hub. Redox Biol. 2024 May;71:103112.

S240801



400 659 9898



support@purescix.com



www.purescix.com

Page 2 of 2