



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **P005091**
CAS 号: **882257-11-6**
产品货号: **S81551**

生物活性:

Description	P005091 是一种有效的, 选择性的泛素特异性蛋白酶 7 (USP7) 抑制剂, EC50 值为 4.2 μM.				
IC50 & Target	EC50: 4.2 μM (USP7)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	HCT-116	IC ₅₀	11 μM	Cytotoxicity against human HCT116 cells after 72 hrs	
				Inhibition of recombinant USP7 expressed in Sf9 cells by	
	Sf9	IC ₅₀	4.2 μM	Ub-CHOP reporter assay	
In Vitro	P005091 是一种三取代噻吩类化合物,其二氯苯硫基、硝基和乙酰基取代基可介导抗 USP7 活性。P005091 对 USP7 表现出强效、特异且选择性的去泛素化活性,而对其他测试的去泛素化酶 (DUBs) 或半胱氨酸蛋白酶家族无抑制作用 (EC50 > 100 mM)。P005091 能以浓度依赖性方式抑制 HA-UbVME 对 USP7 的标记,并以剂量依赖性方式抑制 USP7 介导的高分子量多聚泛素链的切割。此外, P005091 特异性抑制 USP7 (而非 USP2 或 USP8) 介导的 K48 连接多聚泛素链的切割。				
	P005091 通过抑制 USP7 诱导 HDM2 多聚泛素化并加速其降解。在 MM 细胞中, P005091 能抑制 USP7 的去泛素化活性,且不断断蛋白酶体活性。P005091 可抑制 MM 细胞生长并克服硼替佐米耐药性,对多种 MM 细胞系 (包括对常规治疗药物地塞米松 (MM.1R)、阿霉素 (Dox-40) 和美的仑 (LR5) 耐药的细胞系) 均产生剂量依赖性的细胞活力下降 (IC50 范围为 6-14 μM),并能克服骨髓基质细胞诱导的 MM 细胞生长。				
	P005091 可降低 HDM2 和 HDMX 水平,同时上调 p53 和 p21 表达。总体而言, P005091 诱导的细胞毒性部分通过 HDM2-p21 信号轴介导,虽然 p53 在 P005091 处理后表达上调,但其细胞毒活性不依赖于 p53[1].				
In Vivo	在动物肿瘤模型研究中, P005091 表现出良好的耐受性,能有效抑制肿瘤生长并延长生存期。当 P005091 与来那度胺 (lenalidomide)、组蛋白去乙酰化酶抑制剂 SAHA 或地塞米松 (dexamethasone) 联用时,可产生协同抗多发性骨髓瘤 (MM) 活性[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (71.79 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.8717 mL	14.3587 mL	28.7175 mL
		5 mM	0.5743 mL	2.8717 mL	5.7435 mL
		10 mM	0.2872 mL	1.4359 mL	2.8717 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时,请在 2 年内使用, -20°C 储存时,请在 1 年内使用。					
参考文献	[1]. Chauhan D, et al. A small molecule inhibitor of ubiquitin-specific protease-7 induces apoptosis in multiple myeloma cells and overcomes bortezomib resistance. Cancer Cell. 2012 Sep 11;22(3):345-58.				

完整储备液配制表:

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



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积 浓度				
DMSO	1 mM	2.8717 mL	14.3587 mL	28.7175 mL	71.7937 mL
	5 mM	0.5743 mL	2.8717 mL	5.7435 mL	14.3587 mL
	10 mM	0.2872 mL	1.4359 mL	2.8717 mL	7.1794 mL
	15 mM	0.1914 mL	0.9572 mL	1.9145 mL	4.7862 mL
	20 mM	0.1436 mL	0.7179 mL	1.4359 mL	3.5897 mL
	25 mM	0.1149 mL	0.5743 mL	1.1487 mL	2.8717 mL
	30 mM	0.0957 mL	0.4786 mL	0.9572 mL	2.3931 mL
	40 mM	0.0718 mL	0.3590 mL	0.7179 mL	1.7948 mL
	50 mM	0.0574 mL	0.2872 mL	0.5743 mL	1.4359 mL
	60 mM	0.0479 mL	0.2393 mL	0.4786 mL	1.1966 mL

源叶