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：shyysw@sina.com

产品名称：BRD3308
CAS 号：1550053-02-5
产品货号：S87667

生物活性：

Description

BRD3308 是一种高选择性的 HDAC3 抑制剂，IC50 为 54 nM。BRD3308 对 HDAC3 的选择性是 HDAC1 (IC50 为 1.26 μM) 或 HDAC2 (IC50 为 1.34 μM) 的 23 倍。BRD3308 抑制由炎性细胞因子或糖脂毒性应激诱导的胰腺 β 细胞凋亡，并增加功能性胰岛素释放。BRD3308 还可激活 HIV-1 转录并破坏 HIV-1 潜伏期。

IC50 & Target[1|3]

HDAC3	HDAC3	HDAC1	HDAC1
54 nM (IC_{50})	29 nM (Ki)	1260 nM (IC_{50})	5100 nM (Ki)
HDAC2	HDAC2	HIV-1	
1340 nM (IC_{50})	6300 nM (Ki)		

Cellular Effect

Cell Line	Type	Value	Description
Sf9	IC_{50}	1080 nM	Inhibition of recombinant human full length C-terminal His/FALG-tagged HDAC1 expressed in Sf9 insect cells using FAM-labeled acetylated peptide A as substrate preincubated for 3 hrs followed by substrate addition and measured after 60 mins by fluorescence
Sf9	IC_{50}	1150 nM	Inhibition of recombinant human full length C-terminal FLAG-tagged HDAC2 expressed in Sf9 insect cells using FAM-labeled acetylated peptide A as substrate preincubated for 3 hrs followed by substrate addition and measured after 60 mins by fluorescence ass

In Vitro

BRD3308 (5-30 μM；6-24 小时) 处理增加 2D10 细胞系中的 HIV-1 表达[1]。

BRD3308 (15 μM；过夜) 能够诱导生长静息 CD4+ T 细胞中来自体外潜伏感染细胞的 HIV-1[1]。

BRD3308 抑制 HDAC1、HDAC2 和 HDAC3，Ki 值分别为 5.1 μM、6.3 μM 和 29 nM[3]。

RT-PCR[1]

Cell Line:	2D10 cells
Concentration:	5 μM, 10 μM, 15 μM, or 30 μM
Incubation Time:	6 hours, 12 hours, 18 hours, or 24 hours
Result:	An increase in HIV-1 expression was observed.

In Vivo

BRD3308 (5 mg/kg；腹膜内注射；每隔一天；雄性 Zucker 糖尿病肥胖大鼠) 处理可降低 2 型糖尿病大鼠模型中的高血糖并增加胰岛素分泌。在高血糖钳夹结束时，BRD3308 处理大鼠的循环胰岛素水平显著升高。胰腺胰岛素染色和含量也显著升高。BRD3308 在体内保持功能性 β 细胞团抵抗糖脂毒性[2]。

Animal Model:	Male Zucker Diabetic Fatty (Obese) rats (6-week-old)[2]
Dosage:	5 mg/kg
Administration:	Intraperitoneal injection; every second day
Result:	Reduced hyperglycaemia and increased insulin secretion in a rat model of type 2 diabetes.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：250 mg/mL (870.20 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影

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：shyysw@sina.com

响，请使用新开封的 DMSO)

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	3.4808 mL	17.4040 mL	34.8080 mL
	5 mM	0.6962 mL	3.4808 mL	6.9616 mL
	10 mM	0.3481 mL	1.7404 mL	3.4808 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。

动物实验：

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

方案 一

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

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.24 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。

生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH_2O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。

方案 二

请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.24 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。

参考文献

[1]. Barton KM, et al. Selective HDAC inhibition for the disruption of latent HIV-1 infection. PLoS One. 2014 Aug 19;9(8):e102684.

[2]. Lundh M, et al. Histone deacetylase 3 inhibition improves glycaemia and insulin secretion in obese diabetic rats. Diabetes Obes Metab. 2015 Jul;17(7):703-7.

[3]. Wagner FF, et al. An Isochemogenic Set of Inhibitors To Define the Therapeutic Potential of Histone Deacetylases in β-Cell Protection. ACS Chem Biol. 2016 Feb 19;11(2):363-74.

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。

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：shyysw@sina.com

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	3.4808 mL	17.4040 mL	34.8080 mL	87.0201 mL
	5 mM	0.6962 mL	3.4808 mL	6.9616 mL	17.4040 mL
	10 mM	0.3481 mL	1.7404 mL	3.4808 mL	8.7020 mL
	15 mM	0.2321 mL	1.1603 mL	2.3205 mL	5.8013 mL
	20 mM	0.1740 mL	0.8702 mL	1.7404 mL	4.3510 mL
	25 mM	0.1392 mL	0.6962 mL	1.3923 mL	3.4808 mL
	30 mM	0.1160 mL	0.5801 mL	1.1603 mL	2.9007 mL
	40 mM	0.0870 mL	0.4351 mL	0.8702 mL	2.1755 mL
	50 mM	0.0696 mL	0.3481 mL	0.6962 mL	1.7404 mL
	60 mM	0.0580 mL	0.2901 mL	0.5801 mL	1.4503 mL
	80 mM	0.0435 mL	0.2176 mL	0.4351 mL	1.0878 mL
	100 mM	0.0348 mL	0.1740 mL	0.3481 mL	0.8702 mL