



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: **DBET57**
CAS 号: **1883863-52-2**
产品货号: **S87731**

生物活性:

Description	dBET57 是一种有效选择性的 BRD4BD1 降解剂, 基于 PROTAC 技术, 具有诱导细胞凋亡和抗肿瘤活性。dBET57 介导了 E3 泛素连接酶 CRL4Cereblon 的招募, 对 BRD4BD1 作用的 DC50/5h 值为 500 nM 。	
IC50 & Target	BRD4 (BD1) 500 nM (DC ₅₀)	
In Vitro	dBET57 (0-10000 nM, 72 h) 抑制 NB 细胞增殖, SK-N-BE(2), IMR-32, SH-SY5Y, HT22, HPAEC, 293T, HCAEC 的 IC50 分别为 643.4, 299, 414, 2151, 2321, 4840, 3939 nM[1]。	
	dBET57 (0-1200 nM, 48 h) 诱导 NB 细胞凋亡, 并且 G1 期的细胞比例增加[1]。	
	dBET57 (0-1200 nM, 0-48 h) 降低了 NB 细胞的迁移和粘附能力[1]。	
	Cell Viability Assay[1]	
	Cell Line:	SK-N-BE(2), IMR-32, SH-SY5Y, HT22, HPAEC, 293T, HCAEC
	Concentration:	0-10000 nM
	Incubation Time:	48 h
	Result:	Inhibited NB cell proliferation.
	Western Blot Analysis[1]	
	Cell Line:	SK-NBE(2), IMR-32, SH-SY5Y
	Concentration:	0, 300, 600, 1200 nM
	Incubation Time:	48 h
	Result:	Increased PARP activation in a dose-dependent manner, while Bcl-2 expression gradually decreased, reduced the expression of BRD4, BRD2, BRD3, and N-Myc.
	Apoptosis Analysis[1]	
	Cell Line:	SK-NBE(2), IMR-32, SH-SY5Y
	Concentration:	0, 300, 600, 1200 nM
	Incubation Time:	48 h
	Result:	Increased apoptosis rate in a dose-dependent manner.
	Cell Cycle Analysis[1]	
	Cell Line:	SK-NBE(2), IMR-32, SH-SY5Y
	Concentration:	0, 300, 600, 1200 nM
	Incubation Time:	72 h
	Result:	Increased the proportion of NB cells in G1 phase and decreased the proportion of NB cells in G2 and S phase.
	Cell Migration Assay [1]	
	Cell Line:	SK-NBE(2), IMR-32, SH-SY5Y
	Concentration:	0, 1200 nM
	Incubation Time:	48 h
	Result:	Reduced cell migration.
In Vivo	dBET57 (7.5 mg/kg, 腹腔注射, 每日一次, 2 周) 在 SK-NBE(2) 异种移植小鼠模型中有抗肿瘤	



	活性[1]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>SK-NBE(2) xenograft mouse model[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>7.5 mg/kg, daily, 2 weeks</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>Intraperitoneal injection (i.p.)</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Reduced tumor volume, decreased the proportion of ki-67 positive cells, increased the proportion of caspase3, had no obvious organ toxicity, and downregulated the level of ZMYND8.</td></tr></table>	Animal Model:	SK-NBE(2) xenograft mouse model[1]	Dosage:	7.5 mg/kg, daily, 2 weeks	Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.)	Result:	Reduced tumor volume, decreased the proportion of ki-67 positive cells, increased the proportion of caspase3, had no obvious organ toxicity, and downregulated the level of ZMYND8.									
Animal Model:	SK-NBE(2) xenograft mouse model[1]																	
Dosage:	7.5 mg/kg, daily, 2 weeks																	
Administration:	Intraperitoneal injection (i.p.)																	
Result:	Reduced tumor volume, decreased the proportion of ki-67 positive cells, increased the proportion of caspase3, had no obvious organ toxicity, and downregulated the level of ZMYND8.																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (357.56 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) <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent Mass Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.4302 mL</td><td>7.1512 mL</td><td>14.3025 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.2860 mL</td><td>1.4302 mL</td><td>2.8605 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1430 mL</td><td>0.7151 mL</td><td>1.4302 mL</td></tr></table> *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 (protect from light)。-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 (2.97 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 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	1.4302 mL	7.1512 mL	14.3025 mL	5 mM	0.2860 mL	1.4302 mL	2.8605 mL	10 mM	0.1430 mL	0.7151 mL	1.4302 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		1.4302 mL	7.1512 mL	14.3025 mL													
	5 mM		0.2860 mL	1.4302 mL	2.8605 mL													
	10 mM	0.1430 mL	0.7151 mL	1.4302 mL														
参考文献	[1]. Si-Qi Jia, et al. The BRD4 Inhibitor dBET57 Exerts Anticancer Effects by Targeting Superenhancer-Related Genes in Neuroblastoma. J Immunol Res. 2022 Nov 16;2022:7945884. [2]. Nowak RP, et al. Plasticity in binding confers selectivity in ligand-induced protein degradation. Nat Chem Biol. 2018 Jul;14(7):706-714.																	
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 (protect from light)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°																		



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

C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	浓度				
DMSO	1 mM	1.4302 mL	7.1512 mL	14.3025 mL	35.7562 mL
	5 mM	0.2860 mL	1.4302 mL	2.8605 mL	7.1512 mL
	10 mM	0.1430 mL	0.7151 mL	1.4302 mL	3.5756 mL
	15 mM	0.0953 mL	0.4767 mL	0.9535 mL	2.3837 mL
	20 mM	0.0715 mL	0.3576 mL	0.7151 mL	1.7878 mL
	25 mM	0.0572 mL	0.2860 mL	0.5721 mL	1.4302 mL
	30 mM	0.0477 mL	0.2384 mL	0.4767 mL	1.1919 mL
	40 mM	0.0358 mL	0.1788 mL	0.3576 mL	0.8939 mL
	50 mM	0.0286 mL	0.1430 mL	0.2860 mL	0.7151 mL
	60 mM	0.0238 mL	0.1192 mL	0.2384 mL	0.5959 mL
	80 mM	0.0179 mL	0.0894 mL	0.1788 mL	0.4470 mL
	100 mM	0.0143 mL	0.0715 mL	0.1430 mL	0.3576 mL

源叶