



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: **PK11000**
CAS 号: **38275-34-2**
产品货号: **S88103**

生物活性:

Description	PK11000 是一种烷基化剂, 通过共价半胱氨酸修饰稳定 WT 和突变体 p53 蛋白的 DNA 结合域, 而不影响 DNA 结合。PK11000 具有抗肿瘤活性。		
IC50 & Target	p53[1]		
In Vitro	PK11000 (0-120 μM, 24 h) 轻度抑制突变型 p53 癌细胞[1]。		
	PK11000 (0-50 μM, 5 天) 对乳腺细胞系具有抗增殖作用[2]。		
	Cell Viability Assay[1]		
	Cell Line:	WI-38, HUH-6, NUGC-4, SJSA-1, HUH-7, NUGC-3, SW480 and MKN1 cells	
	Concentration:	0-120 μM	
	Incubation Time:	24 hours	
	Result:	Inhibited NUGC-3 cells mildly.	
	Cell Proliferation Assay[2]		
	Cell Line:	UACC812, BT474, ZR-75-1, SUM 159, MDA-MD-468, MDA-MD-453, T47D, Hs578T(i8), MCF7, HCC1937, JimT1, BT20, HCC1143, BT549, SKBR3, MCF12A, MCF10A cells	
	Concentration:	0-50 μM	
Incubation Time:	5 days		
Result:	Inhibited breast cell lines with IC ₅₀ values ranging from 2.5 to >50 μM.		

Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (422.60 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)			
	H2O 中的溶解度 : 25 mg/mL (105.65 mM; 超声助溶)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	Concentration
		1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	4.2260 mL	21.1300 mL
		5 mM	0.8452 mL	4.2260 mL
		10 mM	0.4226 mL	2.1130 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。			
	* 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。			
	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: ≥ 2.5 mg/mL (10.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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；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。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (10.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（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。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (10.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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： PBS Solubility: 20 mg/mL (84.52 mM); 澄清溶液; 超声助溶。											
参考文献	[1]. Bauer MR, et al. 2-Sulfonylpyrimidines: Mild alkylating agents with anticancer activity toward p53-compromised cells. Proc Natl Acad Sci U S A. 2016 Sep 6;113(36):E5271-80. [2]. Naoise C Synnott, et al. Mutant p53 as a therapeutic target for the treatment of triple-negative breast cancer: Preclinical investigation with the anti-p53 drug, PK11007. Cancer Lett. 2018 Feb 1;414:99-106.											
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, 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	<table><tr><th>质量 溶剂体积 浓度</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th><th>25 mg</th></tr><tr><td>H2O / DMSO</td><td>1 mM</td><td>4.2260 mL</td><td>21.1300 mL</td><td>42.2601 mL</td><td>105.6502 mL</td></tr></table>	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg	H2O / DMSO	1 mM	4.2260 mL	21.1300 mL	42.2601 mL	105.6502 mL
质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg								
H2O / DMSO	1 mM	4.2260 mL	21.1300 mL	42.2601 mL	105.6502 mL							



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

	5 mM	0.8452 mL	4.2260 mL	8.4520 mL	21.1300 mL
	10 mM	0.4226 mL	2.1130 mL	4.2260 mL	10.5650 mL
	15 mM	0.2817 mL	1.4087 mL	2.8173 mL	7.0433 mL
	20 mM	0.2113 mL	1.0565 mL	2.1130 mL	5.2825 mL
	25 mM	0.1690 mL	0.8452 mL	1.6904 mL	4.2260 mL
	30 mM	0.1409 mL	0.7043 mL	1.4087 mL	3.5217 mL
	40 mM	0.1057 mL	0.5283 mL	1.0565 mL	2.6413 mL
	50 mM	0.0845 mL	0.4226 mL	0.8452 mL	2.1130 mL
	60 mM	0.0704 mL	0.3522 mL	0.7043 mL	1.7608 mL
	80 mM	0.0528 mL	0.2641 mL	0.5283 mL	1.3206 mL
	100 mM	0.0423 mL	0.2113 mL	0.4226 mL	1.0565 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。

源叶