



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: **SF-2523**
CAS 号: **1174428-47-7**
产品货号: **S88282**

生物活性:

Description	SF2523 是一种有效的选择性 PI3K 抑制剂,抑制 PI3K α , PI3K γ , DNA-PK, BRD4 和 mTOR, IC50 分别为 34 nM, 158 nM, 9 nM, 241 nM 和 280 nM。				
IC50 & Target[1]	PI3Kα 34 nM (IC50)	PI3Kγ 158 nM (IC50)	BRD4 (BD1) 241 nM (IC50)	DNA-PK 9 nM (IC50)	mTOR 280 nM (IC50)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	786-0	IC50	3.3 μM	Inhibition of human 786-O cell proliferation after 72 hrs by spectrophotometric analysis	
	BT-474	IC50	3.8 μM	Inhibition of human BT474 cell proliferation after 72 hrs by spectrophotometric analysis	
	NCI-H1299	IC50	0.9 μM	Inhibition of human H1299 cell proliferation after 72 hrs by spectrophotometric analysis	
	PC-3	IC50	1.6 μM	Inhibition of human PC3 cell proliferation after 72 hrs by spectrophotometric analysis	
In Vitro	SF2523 处理可降低 MYCN 和 Cyclin D1 (MYCN 靶标) 的蛋白质水平,并通过阻断 AKT 在 Ser473 处的磷酸化来抑制 AKT 活化。SF2523 处理导致 BRD4 从两个 MYCN 启动子位点移位。SF2523 与全长 BRD4 (Kd=140 nM) 强烈相互作用,并与 BRD4 第一个 BD (BD1) (Kd=150 nM) 表现出相当的亲和力,但它与 BRD4 的第二个 BD (BD2) (Kd=710 nM) 的结合较弱。比较 SF2523 对其他蛋白质的 BD 的结合亲和力,发现它与 BRD4、BRD2 和 BRD3 的 BD 的结合同样好;与 CECR2 和 BRDT 的 BD 表现出中等程度的结合;但与其他 BD 的结合力要弱得多[2]。				
In Vivo	与对照组相比, SF2523 治疗可显著减少肿瘤体积。SF2523 对接受治疗的小鼠没有明显毒性,因为体重没有明显变化。SF2523 导致小鼠肿瘤中的 MYCN、pAKT 和 Cyclin D1 水平显著降低[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 30 mg/mL (80.77 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响,请使用新开封的 DMSO) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	1 mg	5 mg
		Concentration			
		1 mM	2.6924 mL	13.4622 mL	26.9244 mL
		5 mM	0.5385 mL	2.6924 mL	5.3849 mL
	10 mM	0.2692 mL	1.3462 mL	2.6924 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。 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 (6.73 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 (6.73 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。
参考文献	[1]. Carlino L, et al. Dual Kinase-Bromodomain Inhibitors in Anticancer Drug Discovery: A Structural and Pharmacological Perspective. J Med Chem. 2016 Oct 27;59(20):9305-9320. [2]. Andrews FH, et al. Dual-activity PI3K-BRD4 inhibitor for the orthogonal inhibition of MYC to block tumor growth and metastasis. Proc Natl Acad Sci U S A. 2017 Feb 14;114(7):E1072-E1080.

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	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.6924 mL	13.4622 mL	26.9244 mL	67.3111 mL
	5 mM	0.5385 mL	2.6924 mL	5.3849 mL	13.4622 mL
	10 mM	0.2692 mL	1.3462 mL	2.6924 mL	6.7311 mL
	15 mM	0.1795 mL	0.8975 mL	1.7950 mL	4.4874 mL
	20 mM	0.1346 mL	0.6731 mL	1.3462 mL	3.3656 mL
	25 mM	0.1077 mL	0.5385 mL	1.0770 mL	2.6924 mL
	30 mM	0.0897 mL	0.4487 mL	0.8975 mL	2.2437 mL
	40 mM	0.0673 mL	0.3366 mL	0.6731 mL	1.6828 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

	50 mM	0.0538 mL	0.2692 mL	0.5385 mL	1.3462 mL
	60 mM	0.0449 mL	0.2244 mL	0.4487 mL	1.1219 mL
	80 mM	0.0337 mL	0.1683 mL	0.3366 mL	0.8414 mL



源叶