



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: **PLX51107**
CAS 号: **1627929-55-8**
产品货号: **S88448**

生物活性:

Description	PLX51107 是一种有效的, 选择性的 BET 抑制剂, 对 BRD2, BRD3, BRD4 和 BRDT 的 BD1 结构域的亲和力 Kd 值分别为 1.6, 2.1, 1.7 和 5 nM, BD2 结构域亲和力 Kd 值分别为 5.9, 6.2, 6.1 和 120 nM; PLX51107 同时与 CBP 和 EP300 的结构域相互作用 (Kd, ~ 100 nM)。				
IC50 & Target	Kd: 1.6 nM (BRD2-BD1), 2.1 nM (BRD3-BD1), 1.7 nM (BRD4-BD1), 5 nM (BRDT-BD1), 5.9 nM (BRD2-BD2), 6.2 nM (BRD3-BD2), 6.1 nM (BRD4-BD2), 120 nM (BRDT-BD2), ~ 100 nM (CBP), ~ 100 nM (EP300)[1]				
In Vitro	PLX51107 是一种有效的选择性 BET 抑制剂, 对 BD1 的 Kd 分别为 1.6、2.1、1.7 和 5 nM, 对 BRD2、BRD3、BRD4 的 BD2 的 Kd 分别为 5.9、6.2、6.1 和 120 nM, 和 BRDT。PLX51107 还与 CBP 和 EP300 的溴结构域相互作用 (Kd, 在 100 nM 范围内)。PLX51107 (0.156-10 μM) 抑制 CpG 诱导的原发性慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 细胞增殖。PLX51107 还会引起 p21 和 IκBα 的积累, 降低 c-MYC 水平, 并调节促凋亡和抗凋亡蛋白。PLX51107 选择性地调节 CLL 驱动基因[1].				
In Vivo	PLX51107 (2 mg/kg, 口服) 在 Ba/F3 (小鼠 IL3 依赖性前 B 细胞系) 脾肿大小鼠模型中抑制 75% 的脾肿大, 其效果与 25 mg/kg OTX015 相似。PLX51107 (20 mg/kg, qd, po) 通过每天一次口服给药在侵袭性慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 和里氏转化 (RT) 疾病模型中表现出有效的抗白血病作用[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 75 mg/mL (171.05 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	2.2806 mL	11.4030 mL	22.8061 mL
		5 mM	0.4561 mL	2.2806 mL	4.5612 mL
		10 mM	0.2281 mL	1.1403 mL	2.2806 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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.70 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 (5.70 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 (5.70 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。
参考文献	[1]. Ozer HG, et al. BRD4 Profiling Identifies Critical Chronic Lymphocytic Leukemia Oncogenic Circuits and Reveals Sensitivity to PLX51107, a Novel Structurally Distinct BET Inhibitor. Cancer Discov. 2018 Apr;8(4):458-477.

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, 1 year; -20° C, 6 months。 -80° C 储存时, 请在 1 年内使用, -20° C 储存时, 请在 6 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
DMSO	1 mM	2.2806 mL	11.4030 mL	22.8061 mL	57.0151 mL
	5 mM	0.4561 mL	2.2806 mL	4.5612 mL	11.4030 mL
	10 mM	0.2281 mL	1.1403 mL	2.2806 mL	5.7015 mL
	15 mM	0.1520 mL	0.7602 mL	1.5204 mL	3.8010 mL
	20 mM	0.1140 mL	0.5702 mL	1.1403 mL	2.8508 mL
	25 mM	0.0912 mL	0.4561 mL	0.9122 mL	2.2806 mL
	30 mM	0.0760 mL	0.3801 mL	0.7602 mL	1.9005 mL
	40 mM	0.0570 mL	0.2851 mL	0.5702 mL	1.4254 mL
	50 mM	0.0456 mL	0.2281 mL	0.4561 mL	1.1403 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

	60 mM	0.0380 mL	0.1901 mL	0.3801 mL	0.9503 mL
	80 mM	0.0285 mL	0.1425 mL	0.2851 mL	0.7127 mL
	100 mM	0.0228 mL	0.1140 mL	0.2281 mL	0.5702 mL



源叶