



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: (S,R,S)-AHPC-Me (VHL ligand 2)(hydrochloride)

CAS 号: 1948273-02-6 (free base)

产品货号: S88539

生物活性:

Description	(S,R,S)-AHPC-Me (VHL ligand 2) 是一种基于 (S,R,S)-AHPC 的, 可募集 von Hippel-Lindau (VHL) 蛋白的 VHL 配体。(S,R,S)-AHPC-Me 可用于合成 ARV-771。ARV-771 是一种基于 VHL E3 连接酶的 BET PROTAC 降解剂。ARV-771 可有效降解去势抵抗性前列腺癌 (CRPC) 细胞中的 BET 蛋白, DC 50 <1 nM。				
IC50 & Target	VHL				
In Vitro	VHL 蛋白是两种普遍表达且具有生物学重要性的 Cullin RING E3 泛素连接酶复合物的底物识别亚基。VHL 是最流行的 E3 连接酶之一, 被双功能蛋白水解靶向嵌合体 (PROTAC) 招募来诱导泛素化和随后的蛋白酶体降解目标蛋白质[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (224.92 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)				
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	2.2492 mL	11.2460 mL	22.4921 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4498 mL	2.2492 mL	4.4984 mL
		10 mM	0.2249 mL	1.1246 mL	2.2492 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 (4.68 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。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.68 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 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.68 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Raina K, et al. PROTAC-induced BET protein degradation as a therapy for castration-resistant prostate cancer. Proc Natl Acad Sci U S A. 2016 Jun 28;113(26):7124-9.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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
DMSO	1 mM	2.2492 mL	11.2460 mL	22.4921 mL	56.2302 mL
	5 mM	0.4498 mL	2.2492 mL	4.4984 mL	11.2460 mL
	10 mM	0.2249 mL	1.1246 mL	2.2492 mL	5.6230 mL
	15 mM	0.1499 mL	0.7497 mL	1.4995 mL	3.7487 mL
	20 mM	0.1125 mL	0.5623 mL	1.1246 mL	2.8115 mL
	25 mM	0.0900 mL	0.4498 mL	0.8997 mL	2.2492 mL
	30 mM	0.0750 mL	0.3749 mL	0.7497 mL	1.8743 mL
	40 mM	0.0562 mL	0.2812 mL	0.5623 mL	1.4058 mL
	50 mM	0.0450 mL	0.2249 mL	0.4498 mL	1.1246 mL
	60 mM	0.0375 mL	0.1874 mL	0.3749 mL	0.9372 mL
	80 mM	0.0281 mL	0.1406 mL	0.2812 mL	0.7029 mL
	100 mM	0.0225 mL	0.1125 mL	0.2249 mL	0.5623 mL