



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: shyyw@sina.com

产品名称: **BI-1347**
CAS 号: **2163056-91-3**
产品货号: **S88587**

生物活性:				
Description	BI-1347 是一种具有口服活性的、选择性和强效的 CDK8 抑制剂 (IC50=1.1 nM), 且具有抗肿瘤活性。			
IC50 & Target[1]	CDK8 1.1 nM (IC50)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HCT-116	IC50	32.94 μM	Antiproliferative activity against human HCT-116 cells assessed as inhibition of cell proliferation incubated for 4 days by Celltiter glo luminescent assay
	HEK293	EC50	5 nM	Inhibition of mouse derived homozygous Tg0N4R P301S mutant tau-induced human ON4R tau aggregation harboring P301S mutant transfected in HEK293 cells preincubated for 2 hrs followed by compound addition and measured after 3 hrs by YFP-based fluorescence assay
	MDA-MB-231	IC50	28.65 μM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells assessed as inhibition of cell proliferation incubated for 4 days by Celltiter glo luminescent assay
	MDA-MB-468	IC50	28.82 μM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-468 cells assessed as inhibition of cell proliferation incubated for 4 days by Celltiter glo luminescent assay
In Vitro	BI-1347 (150 nM; 44 小时) 可增强小鼠脾脏 NK 细胞中颗粒酶 B (GZMB+) 的产生[2]。 BI-1347 (0.1 nM-10 μM; 24 小时) 治疗可增加 NK92MI 细胞中穿孔素的分泌[2]。 Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:	Mouse splenic NK cells		
	Concentration:	150 nM		
	Incubation Time:	44 hours		
	Result:	Increased the proportion of granzyme B-positive NK cells by approximately 4-fold.		
	Western Blot Analysis[2]			
	Cell Line:	Human NK92MI cells		
	Concentration:	0.1 nM-10 μM		
	Incubation Time:	24 hours		
	Result:	Increased perforin levels with an EC50 value of 7.2 nM.		
In Vivo	BI-1347 (灌胃; 10 mg/kg; 每日一次; 30 天) 调节 STAT1S727 磷酸化并显示体内抗肿瘤活性[2]。 BI-1347 (灌胃; 10 mg/kg) 间歇性方案和 BI-8382 持续联合给药在乳腺癌 EMT6 模型中与提高了单一疗法的药效[2]。			
	Animal Model:	B16-F10-luc2 syngeneic melanoma model[2]		
	Dosage:	10 mg/kg		



	Administration: Result:	Oral gavage; 10 mg/kg; once daily; 30 d Reduced phosphorylation of STAT1^{S727} for at least 6 h by 60%. Showed minimal effect on body weight at 10 mg/kg. Showed lower tumor burden both on day 23 and 29, compared to the control group.		
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (350.71 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 Concentration Mass	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	2.8057 mL	14.0284 mL	28.0568 mL
	5 mM	0.5611 mL	2.8057 mL	5.6114 mL
	10 mM	0.2806 mL	1.4028 mL	2.8057 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.84 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 ddH ₂ O 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 (5.84 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 → 90% Corn Oil				
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.84 mM); 澄清溶液				



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

	此方案可获得 ≥ 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Harald Engelhardt, et al. New phenylpyrazolylacetamide compounds and derivatives as cdk8/cdk19 inhibitors. [2]. Hofmann MH, et al. Selective and Potent CDK8/19 Inhibitors Enhance NK-Cell Activity and Promote Tumor Surveillance. Mol Cancer Ther. 2020 Apr;19(4):1018-1030.

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	2.8057 mL	14.0284 mL	28.0568 mL	70.1420 mL
	5 mM	0.5611 mL	2.8057 mL	5.6114 mL	14.0284 mL
	10 mM	0.2806 mL	1.4028 mL	2.8057 mL	7.0142 mL
	15 mM	0.1870 mL	0.9352 mL	1.8705 mL	4.6761 mL
	20 mM	0.1403 mL	0.7014 mL	1.4028 mL	3.5071 mL
	25 mM	0.1122 mL	0.5611 mL	1.1223 mL	2.8057 mL
	30 mM	0.0935 mL	0.4676 mL	0.9352 mL	2.3381 mL
	40 mM	0.0701 mL	0.3507 mL	0.7014 mL	1.7535 mL
	50 mM	0.0561 mL	0.2806 mL	0.5611 mL	1.4028 mL
	60 mM	0.0468 mL	0.2338 mL	0.4676 mL	1.1690 mL
	80 mM	0.0351 mL	0.1754 mL	0.3507 mL	0.8768 mL
	100 mM	0.0281 mL	0.1403 mL	0.2806 mL	0.7014 mL