



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: **PFI-3**
CAS 号: **1819363-80-8**
产品货号: **S88799**

生物活性:				
Description	PFI-3 是一种化学探针,是高效,选择性,可渗透细胞的 SMARCA2/4 溴结构域抑制剂, Kd 值为 89 nM。			
IC50 & Target	Kd: 89 nM (SMARCA2/4)[1]			
In Vitro	PFI-3 是一种强效的细胞通透性探针,能够取代染色质中异位表达的 GFP 标记的 SMARCA2 溴结构域。PFI-3 与 SMARCA2 和 SMARCA4 溴结构域均能紧密结合 (BROMOScan Kd 介于 55 至 110 nM 之间),这与通过恒温滴定量热法测得的结合常数 (Kd=89 nM) 一致。PFI-3 无法表型复制 SMARCA2 敲低对肺癌细胞的生长抑制作用[1]。 胚胎干细胞暴露于 PFI-3 会导致干细胞特性丧失,并导致谱系特化失调。此外,在 PFI-3 存在下,滋养层干细胞的分化显著增强[2]。 PFI-3 可与某些 VIII 家族溴结构域结合,同时表现出显著且更广泛的溴结构域家族选择性。PFI-3 对 VIII 家族的高特异性是通过一种新型的酚基头部溴结构域结合模式实现的,这种模式会导致水分子发生异常置换,而迄今为止已报道的大多数其他溴结构域抑制剂通常会保留水分子[3]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (311.17 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
		1 mM	3.1117 mL	15.5584 mL
		5 mM	0.6223 mL	3.1117 mL
		10 mM	0.3112 mL	1.5558 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: ≥ 2.25 mg/mL (7.00 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 22.5 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: ≥ 2.25 mg/mL (7.00 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 22.5 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: ≥ 2.25 mg/mL (7.00 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.25 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 22.5 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]. Vangamudi B, et al. The SMARCA2/4 ATPase Domain Surpasses the Bromodomain as a Drug Target in SWI/SNF-Mutant Cancers: Insights from cDNA Rescue and PFI-3 Inhibitor Studies. Cancer Res. 2015 Sep 15;75(18):3865-78. [2]. Fedorov O, et al. Selective targeting of the BRG/PB1 bromodomains impairs embryonic and trophoblast stem cell maintenance. Sci Adv. 2015 Nov 13;1(10):e1500723. [3]. Gerstenberger BS, et al. Identification of a Chemical Probe for Family VIII Bromodomains through Optimization of a Fragment Hit. J Med Chem. 2016 May 26;59(10):4800-11.

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	3.1117 mL	15.5584 mL	31.1168 mL	77.7920 mL
	5 mM	0.6223 mL	3.1117 mL	6.2234 mL	15.5584 mL
	10 mM	0.3112 mL	1.5558 mL	3.1117 mL	7.7792 mL
	15 mM	0.2074 mL	1.0372 mL	2.0745 mL	5.1861 mL
	20 mM	0.1556 mL	0.7779 mL	1.5558 mL	3.8896 mL
	25 mM	0.1245 mL	0.6223 mL	1.2447 mL	3.1117 mL
	30 mM	0.1037 mL	0.5186 mL	1.0372 mL	2.5931 mL
	40 mM	0.0778 mL	0.3890 mL	0.7779 mL	1.9448 mL
	50 mM	0.0622 mL	0.3112 mL	0.6223 mL	1.5558 mL
	60 mM	0.0519 mL	0.2593 mL	0.5186 mL	1.2965 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: shyysw@sina.com

	80 mM	0.0389 mL	0.1945 mL	0.3890 mL	0.9724 mL
	100 mM	0.0311 mL	0.1556 mL	0.3112 mL	0.7779 mL



源叶