



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: **NEO2734**
CAS 号: **2081072-29-7**
产品货号: **S89091**

生物活性:

Description	NEO2734 (EP31670) 是具有口服活性的 p300/CBP 和 BET bromodomain 的选择性抑制剂，其 IC50 值均 <30 nM。NEO2734 在 SPOP 突变型和野生型前列腺癌模型中均有活性。				
IC50 & Target	CBP/p300				
In Vitro	NEO2734 (1 μM) 诱导分化和 G1 期细胞周期停滞[1]。				
	NEO2734 (1 μM) 在 NMC 细胞系中快速诱导鳞状分化，并表达末端鳞状分化标记、外皮蛋白或角蛋白[1]。				
	NEO2734 在体外和体内的热点突变体 (F133V) 和非热点突变体 (Q165P) PCa 细胞中均有活性 [2]。				
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	NUT carcinoma patient cell lines (TC-797 and PER-403).			
	Concentration:	1 μM.			
	Incubation Time:	6 h.			
In Vivo	Result:	Results in greater loss of MYC protein.			
	NEO2734 (5、8、10 mg/kg, 口服) 在临床前异种移植模型中抑制生长并延长存活期[1]。				
	Animal Model:	Mice (PER-403 and 14169 models)[1].			
	Dosage:	5, 8, 10 mg/kg			
	Administration:	Orally, once daily for 28 days.			
Solvent&Solubility	Result:	Two of the three mice treated with NEO2734 were alive by day 100. Provided markedly improved survival compared with EP, i-BET-762, and even iBET-762+EP by day 100 following initiation of treatment.			
	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (229.65 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	2.2965 mL	11.4826 mL	22.9653 mL
5 mM		0.4593 mL	2.2965 mL	4.5931 mL	
10 mM		0.2297 mL	1.1483 mL	2.2965 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.74 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 (5.74 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 (5.74 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]. Chevaun D Morrison-Smit, et al. Combined Targeting of the BRD4-NUT-p300 Axis in NUT Midline Carcinoma by Dual Selective Bromodomain Inhibitor, NEO2734. Mol Cancer Ther. 2020 Jul;19(7):1406-1414. [2]. Yuqian Yan, et al. The novel BET-CBP/p300 dual inhibitor NEO2734 is active in SPOP mutant and wild-type prostate cancer. EMBO Mol Med. 2019 Nov 7;11(11):e10659.				
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, 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。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2965 mL	11.4826 mL	22.9653 mL	57.4132 mL
	5 mM	0.4593 mL	2.2965 mL	4.5931 mL	11.4826 mL
	10 mM	0.2297 mL	1.1483 mL	2.2965 mL	5.7413 mL
	15 mM	0.1531 mL	0.7655 mL	1.5310 mL	3.8275 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

	20 mM	0.1148 mL	0.5741 mL	1.1483 mL	2.8707 mL
	25 mM	0.0919 mL	0.4593 mL	0.9186 mL	2.2965 mL
	30 mM	0.0766 mL	0.3828 mL	0.7655 mL	1.9138 mL
	40 mM	0.0574 mL	0.2871 mL	0.5741 mL	1.4353 mL
	50 mM	0.0459 mL	0.2297 mL	0.4593 mL	1.1483 mL
	60 mM	0.0383 mL	0.1914 mL	0.3828 mL	0.9569 mL
	80 mM	0.0287 mL	0.1435 mL	0.2871 mL	0.7177 mL
	100 mM	0.0230 mL	0.1148 mL	0.2297 mL	0.5741 mL



源叶