



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: **BSJ-4-116**
CAS 号: **2519823-34-6**
产品货号: **S89250**

生物活性:

Description	BSJ-4-116 是由 Cereblon 配体和 CDK 配体相连的 PROTAC。BSJ-4-116 是一种高效且选择性的 CDK12 降解剂, IC50 为 6 nM。BSJ-4-116 通过提前终止转录来下调 DDR 基因, 主要是通过增加聚腺苷酸化。BSJ-4-116 单独或与聚(ADP-核糖)聚合酶抑制剂 Olaparib 联合使用时表现出有效的抗增殖作用。				
IC50 & Target[1]	CDK12 6 nM (IC50)	Cereblon			
In Vitro	BSJ-4-116 (10-10000 nM; 72 小时) 对 Kelly CDK12C1039F 细胞表现出强效的抗增殖作用[1]。 BSJ-4-116 (50 nM; 6-24 小时) 可降低 CDK12 蛋白水平, 无论细胞系的突变状态如何[1]。 BSJ-4-116 可抑制 T-ALL 细胞 (Jurkat 和 MOLT-4 细胞) 的生长, 并使其对 PARP 抑制敏感 [1]。 BSJ-4-116 通过聚腺苷酸化调控 DDR 基因。BSJ-4-116 可克服 CDK12C1039F 突变。BSJ-4-116 代表了第一个对二价降解分子产生抗性的例子, 这种抗性是由于目标蛋白质中发生获得性点突变而导致的[1]。				
	Cell Proliferation Assay[1]				
	Cell Line:	Parental Kelly and CDK12 ^{C1039F} cells			
	Concentration:	10-10000 nM			
	Incubation Time:	72 hours			
	Result:	Antiproliferative activity of BSJ-4-116 is independent of the mutational status, and the degrader compounds exhibited improved GR ₅₀ (growth rate inhibition) values in Kelly CDK12 ^{C1039F} cells compared with the parental cell line.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	Parental and CDK12 ^{C1039F} (KellyCDK12CF)-expressing Kelly cells			
	Concentration:	50 nM			
	Incubation Time:	6-24 hours			
	Result:	Led to the same level of CDK12 protein level decrease, regardless of the mutational status of the cell line.			
	Solvent&Solubility	细胞实验:			
		DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (119.42 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	1.1942 mL	5.9710 mL	11.9420 mL
		5 mM	0.2388 mL	1.1942 mL	2.3884 mL
		10 mM	0.1194 mL	0.5971 mL	1.1942 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。					



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: shyyysw@sina.com

	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 (2.48 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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (2.48 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, 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]. Jiang B, et al. Discovery and resistance mechanism of a selective CDK12 degrader. Nat Chem Biol. 2021;17(6):675-683.

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	1.1942 mL	5.9710 mL	11.9420 mL	29.8550 mL
	5 mM	0.2388 mL	1.1942 mL	2.3884 mL	5.9710 mL
	10 mM	0.1194 mL	0.5971 mL	1.1942 mL	2.9855 mL
	15 mM	0.0796 mL	0.3981 mL	0.7961 mL	1.9903 mL
	20 mM	0.0597 mL	0.2986 mL	0.5971 mL	1.4928 mL
	25 mM	0.0478 mL	0.2388 mL	0.4777 mL	1.1942 mL
	30 mM	0.0398 mL	0.1990 mL	0.3981 mL	0.9952 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

	40 mM	0.0299 mL	0.1493 mL	0.2986 mL	0.7464 mL
	50 mM	0.0239 mL	0.1194 mL	0.2388 mL	0.5971 mL
	60 mM	0.0199 mL	0.0995 mL	0.1990 mL	0.4976 mL
	80 mM	0.0149 mL	0.0746 mL	0.1493 mL	0.3732 mL
	100 mM	0.0119 mL	0.0597 mL	0.1194 mL	0.2986 mL



源叶