



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1**

CAS 号: **2270879-17-7**

产品货号: **S89276**

|                    |                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
|--------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------|
| 生物活性:              |                                                                                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Description        | BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1 (compound 14) 是一种具有口服活性的变构 brahma 同系物 (BRM)/SMARCA2 (SWI/SNF 相关的染色质亚家族成员 2 的基质相关肌动蛋白依赖调节因子) 和 brahma 相关基因 1 (BRG1)/SMARCA4 三磷酸腺苷酶活性双抑制剂, IC50 值均低于 0.005 μM。BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1 具有抗癌活性。            |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| IC50 & Target      | IC50: < 0.005 μM (BRM, BRG1)[1].                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Cellular Effect    | Cell Line                                                                                                                                                                                                                        | Type                                                                                                                                                                                 | Value                                                                                                                                        | Description                                                                                                                                           |            |
|                    | SBC-5                                                                                                                                                                                                                            | EC <sub>50</sub>                                                                                                                                                                     | > 10 μM                                                                                                                                      | Antiproliferative activity against human SBC5 cells assessed as cell growth inhibition after 6 days by celltiter-glo luminescent cell viability assay |            |
| In Vitro           | BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1 (compound 14) (0-10 μM, 5 days) 可以抑制癌细胞的增殖[1]。<br>BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1 抑制 KRT80 基因的表达,在 H1299 细胞中的 AAC50 (绝对 AC50) 值为 0.01 μM, 在 RERF-LC-AI 细胞中的 AAC50 为 0.01 μM[1]。<br>Cell Proliferation Assay[1] |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
|                    | Cell Line:                                                                                                                                                                                                                       |                                                                                                                                                                                      | SKMEL5 melanoma cells and SBC-5 small cell carcinoma                                                                                         |                                                                                                                                                       |            |
|                    | Concentration:                                                                                                                                                                                                                   |                                                                                                                                                                                      | 0-10 μM                                                                                                                                      |                                                                                                                                                       |            |
|                    | Incubation Time:                                                                                                                                                                                                                 |                                                                                                                                                                                      | 5 days                                                                                                                                       |                                                                                                                                                       |            |
|                    | Result:                                                                                                                                                                                                                          |                                                                                                                                                                                      | Inhibited the proliferation of SKMEL5 cells with an AAC50(absolute AC50) value of 0.004 μM and of SBC-5 cells with the AAC50more than 10 μM. |                                                                                                                                                       |            |
|                    | In Vivo                                                                                                                                                                                                                          | BRM/BRG1 ATP Inhibitor-1 (化合物 14) (口服, 7.5 或 20 mg/kg, 每天, 3 周) 可抑制肿瘤生长, 并呈剂量依赖性抑制 KRT80 表达[1]。                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Animal Model:      |                                                                                                                                                                                                                                  | Female athymic nude mice with RERF-LC-AI tumor xenografts[1]                                                                                                                         |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Dosage:            |                                                                                                                                                                                                                                  | 7.5 mg/kg, 20 mg/kg                                                                                                                                                                  |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Administration:    |                                                                                                                                                                                                                                  | Oral administration; everyday; 3 weeks                                                                                                                                               |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Result:            |                                                                                                                                                                                                                                  | Inhibited tumor growth by 21% and 55% at doses of 7.5 mg/kg and 20 mg/kg, respectively.<br><br>Inhibited KRT80 expression by up to 90% at 20 mg/kg for 7 hours after administration. |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |
| Solvent&Solubility |                                                                                                                                                                                                                                  | 细胞实验:<br>DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (628.40 mM); 超声助溶 (<60°C); 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                                                                                                                                                                                 | 3.1420 mL                                                                                                                                    | 15.7099 mL                                                                                                                                            | 31.4199 mL |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                  | 5 mM                                                                                                                                                                                 | 0.6284 mL                                                                                                                                    | 3.1420 mL                                                                                                                                             | 6.2840 mL  |
|                    |                                                                                                                                                                                                                                  | 10 mM                                                                                                                                                                                | 0.3142 mL                                                                                                                                    | 1.5710 mL                                                                                                                                             | 3.1420 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。<br>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                                                                                          |                                                                                                                                                                                      |                                                                                                                                              |                                                                                                                                                       |            |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                        |
|------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>存时,请在1年内使用。</p> <p><b>动物实验:</b></p> <p>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。</p> <p>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:</p> <p>——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;</p> <p>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</p> <p>方案 一</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.54 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。</p> <p>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。</p> <p>生理盐水的配制:将 0.9 g 氯化钠,溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL,可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.54 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。</p> <p>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。</p> <p>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.54 mM); 澄清溶液</p> <p>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。</p> <p>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。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Papillon JPN, et al. Discovery of Orally Active Inhibitors of Brahma Homolog (BRM)/SMARCA2 ATPase Activity for the Treatment of Brahma Related Gene 1 (BRG1)/SMARCA4-Mutant Cancers. J Med Chem. 2018 Nov 21;61(22):10155-10172.</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                           |

**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   | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------|-----------|------------|------------|------------|
|      | 溶剂体积 |           |            |            |            |
|      | 浓度   |           |            |            |            |
| DMSO | 1 mM | 3.1420 mL | 15.7099 mL | 31.4199 mL | 78.5497 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyw@sina.com

|  |               |           |           |           |            |
|--|---------------|-----------|-----------|-----------|------------|
|  | <b>5 mM</b>   | 0.6284 mL | 3.1420 mL | 6.2840 mL | 15.7099 mL |
|  | <b>10 mM</b>  | 0.3142 mL | 1.5710 mL | 3.1420 mL | 7.8550 mL  |
|  | <b>15 mM</b>  | 0.2095 mL | 1.0473 mL | 2.0947 mL | 5.2366 mL  |
|  | <b>20 mM</b>  | 0.1571 mL | 0.7855 mL | 1.5710 mL | 3.9275 mL  |
|  | <b>25 mM</b>  | 0.1257 mL | 0.6284 mL | 1.2568 mL | 3.1420 mL  |
|  | <b>30 mM</b>  | 0.1047 mL | 0.5237 mL | 1.0473 mL | 2.6183 mL  |
|  | <b>40 mM</b>  | 0.0785 mL | 0.3927 mL | 0.7855 mL | 1.9637 mL  |
|  | <b>50 mM</b>  | 0.0628 mL | 0.3142 mL | 0.6284 mL | 1.5710 mL  |
|  | <b>60 mM</b>  | 0.0524 mL | 0.2618 mL | 0.5237 mL | 1.3092 mL  |
|  | <b>80 mM</b>  | 0.0393 mL | 0.1964 mL | 0.3927 mL | 0.9819 mL  |
|  | <b>100 mM</b> | 0.0314 mL | 0.1571 mL | 0.3142 mL | 0.7855 mL  |



源叶