



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: **PT2977**
CAS 号: **1672668-24-4**
产品货号: **S89389**

生物活性:

Description	Belzutifan (PT2977) 是一种口服有效的, 选择性 HIF-2 α 抑制剂, IC50 为 9 nM。Belzutifan 作为第二代 HIF-2 α 抑制剂, 可提高效力并改善药代动力学特征。Belzutifan 有抑制透明细胞肾细胞癌(ccRCC) 作用。				
IC50 & Target	IC50: 9 nM (HIF-2 α) [1]				
In Vitro	Belzutifan (PT2977) 可有效且剂量依赖性地降低人细胞周期蛋白 D1 (一种受 HIF-2 α 调节的靶基因) 的 mRNA 水平, 并导致 EPO 表达的快速且剂量依赖性降低[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: Acetone 中的溶解度 : 50 mg/mL (130.43 mM; 超声助溶) DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (130.43 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) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble))				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.6087 mL	13.0433 mL	26.0865 mL
		5 mM	0.5217 mL	2.6087 mL	5.2173 mL
		10 mM	0.2609 mL	1.3043 mL	2.6087 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, 1 year; -20°C, 6 months (stored under nitrogen)。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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 (6.52 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 (6.52 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (6.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 1% DMSO $\rightarrow$ 99% Saline Solubility: $\geq$ 0.5 mg/mL (1.30 mM); 澄清溶液。
参考文献	[1]. Xu R, et al. 3-[(1S,2S,3R)-2,3-Difluoro-1-hydroxy-7-methylsulfonylindan-4-yl]oxy-5-fluorobenzonitrile (PT2977), a Hypoxia-Inducible Factor 2α (HIF-2α) Inhibitor for the Treatment of Clear Cell Renal Cell Carcinoma. J Med Chem. 2019 Aug 8;62(15):6876-6893.

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 $^{\circ}$ C, 1 year; -20 $^{\circ}$ C, 6 months (stored under nitrogen)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 1 年内使用, -20 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 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
Acetone / DMSO	1 mM	2.6087 mL	13.0433 mL	26.0865 mL	65.2163 mL
	5 mM	0.5217 mL	2.6087 mL	5.2173 mL	13.0433 mL
	10 mM	0.2609 mL	1.3043 mL	2.6087 mL	6.5216 mL
	15 mM	0.1739 mL	0.8696 mL	1.7391 mL	4.3478 mL
	20 mM	0.1304 mL	0.6522 mL	1.3043 mL	3.2608 mL
	25 mM	0.1043 mL	0.5217 mL	1.0435 mL	2.6087 mL
	30 mM	0.0870 mL	0.4348 mL	0.8696 mL	2.1739 mL
	40 mM	0.0652 mL	0.3261 mL	0.6522 mL	1.6304 mL
	50 mM	0.0522 mL	0.2609 mL	0.5217 mL	1.3043 mL
	60 mM	0.0435 mL	0.2174 mL	0.4348 mL	1.0869 mL
	80 mM	0.0326 mL	0.1630 mL	0.3261 mL	0.8152 mL
	100 mM	0.0261 mL	0.1304 mL	0.2609 mL	0.6522 mL