



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

产品名称: **CX-6258 hydrochloride**

CAS 号: **1353859-00-3**

产品货号: **T16872**

生物活性:				
Description	CX-6258 hydrochloride is a potent and kinase selective pan-Pim kinases inhibitor, with IC50s of 5 nM, 25 nM and 16 nM for Pim-1, Pim-2 and Pim-3, respectively[1].			
IC50 & Target	IC50: 5 nM (Pim-1), 25 nM (Pim-2), 16 nM (Pim-3)[1].			
In Vitro	CX-6258 hydrochloride 分别在 Pim 激酶特异性位点 S112 和 S65 以及 T37/46 引起剂量依赖性抑制两种促存活蛋白 Bad 和 4E-BP1 的磷酸化[1]。 CX-6258 hydrochloride 处理 (12 mM, 3 小时) 处理降低了 PC3 细胞中异位 NKX3.1 的稳态水平[2]。 CX-6258 hydrochloride 处理导致 NKX3.1 半衰期显著缩短[2]。 Cell Line: MV-4-11 human AML cells. Concentration: 0.1 μM, 1 μM, 10 μM. Incubation Time: 2 hours. Result: Caused dose dependent inhibition of the phosphorylation of two pro-survival proteins, Bad and 4E-BP1, at the Pim kinase specific sites S112 and S65 and T37/46, respectively.			
In Vivo	CX-6258 hydrochloride 分别在 Pim 激酶特异性位点 S112 和 S65 以及 T37/46 引起剂量依赖性抑制两种促存活蛋白 Bad 和 4E-BP1 的磷酸化[1]。 CX-6258 hydrochloride 处理 (12 mM, 3 小时) 处理降低了 PC3 细胞中异位 NKX3.1 的稳态水平[2]。 CX-6258 hydrochloride 处理导致 NKX3.1 半衰期显著缩短[2]。 Animal Model: Nude mice, MV-4-11 xenograft models[1] Dosage: 50 mg/kg, 100 mg/kg. Administration: Oral administration; once daily; over a period of 21 days. Result: Exhibited dose dependent efficacy, with a 50 mg/kg dose producing 45% tumor growth inhibition (TGI) and a 100 mg/kg dose producing 75% TGI.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 10 mg/mL (20.06 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 : 1 mg/mL (2.01 mM; 超声助溶 (<60° C))			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
		1 mM	1 mg	5 mg
		5 mM	10.0321 mL	10 mg
	10 mM	0.4013 mL	2.0064 mL	20.0642 mL
	20 mM	0.2006 mL	1.0032 mL	4.0128 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 (sealed storage, away from moisture)。-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				



	请您现用现配, 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 (5.02 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。
参考文献	[1]. Mustapha Haddach, Jerome Michaux, Michael K, Discovery of CX-6258. A Potent, Selective, and Orally Efficacious pan-Pim Kinases Inhibitor. ACS Med. Chem. Lett., 2012, 3 (2), pp 135-139. [2]. Padmanabhan A, Gosc EB, Bieberich CJ. Stabilization of the prostate-specific tumor suppressor NKX3.1 by the oncogenic protein kinase Pim-1 in prostate cancer cells. J Cell Biochem. 2013 May;114(5):1050-7.

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 (sealed storage, away from moisture)。-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
H ₂ O / DMSO	1 mM	2.0064 mL	10.0321 mL	20.0642 mL	50.1605 mL
DMSO	5 mM	0.4013 mL	2.0064 mL	4.0128 mL	10.0321 mL
	10 mM	0.2006 mL	1.0032 mL	2.0064 mL	5.0161 mL
	15 mM	0.1338 mL	0.6688 mL	1.3376 mL	3.3440 mL
	20 mM	0.1003 mL	0.5016 mL	1.0032 mL	2.5080 mL

* 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。