



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: **BX517**
产品别名: **BX517**

生物活性:				
Description	BX517 is a potent and selective inhibitor of PDK1 with IC ₅₀ of 6 nM.			
IC₅₀ & Target	IC ₅₀ : 6 nM (PDK1)			
In Vitro	BX-517 blocks activation of Akt in tumor cells, is potent with IC ₅₀ of 0.1-1.0 μM[1]. BX-517 blocks AKT2 activation in cells with submicromolar potency. BX-517 is 100-fold selective or better against a panel of seven additional Ser/Thr and Tyr kinases[2].			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 27 mg/mL (95.64 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
		1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	3.5423 mL	17.7117 mL	35.4233 mL
	Stock Solutions	0.7085 mL	3.5423 mL	7.0847 mL
		0.3542 mL	1.7712 mL	3.5423 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℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。 In Vivo: 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 1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.86 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.86 mM, 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，向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。			
References	[1]. Islam I, et al. Indolinone based phosphoinositide-dependent kinase-1 (PDK1) inhibitors. Part 2: optimization of BX-517. Bioorg Med Chem Lett. 2007 Jul 15;17(14):3819-25. [2]. Islam I, et al. Indolinone based phosphoinositide-dependent kinase-1 (PDK1) inhibitors. Part 1: design, synthesis and biological activity. Bioorg Med Chem Lett. 2007 Jul 15;17(14):3814-8.			