

OTX-015 ; OTX015

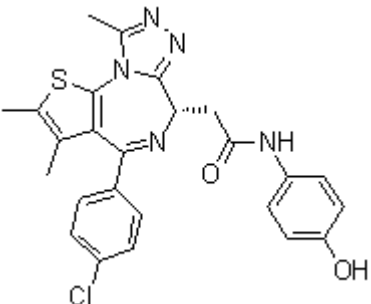
产品编号：MB3315

质量标准：>98%,BET bromodomain 抑制剂

包装规格：5MG;20MG;100MG

产品形式：粉末

基本信息

分子式	C25H22ClN5O2S	结构式	
分子量	491.99		
CAS No.	202590-98-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 98 mg/mL (199.19 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol 98 mg/mL (199.19 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：OTX-015 是一种有效的 BRD2/3/4 抑制剂，IC₅₀ 值为 92-112 nM。

别名：MK-8628; Birabresib ; OTX 015;OTX-015;

(S)-4-(4-Chlorophenyl)-N-(4-hydroxyphenyl)-2,3,9-trimethyl-6H-thieno[3,2-f][1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]diazepine-6-acetamide

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO 98 mg/mL (199.19 mM) ;Water :Insoluble ;Ethanol 98 mg/mL (199.19 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	OTX015 是一种有效的 BET bromodomain 抑制剂，在无细胞试验中对 BRD2，BRD3，和 BRD4 的 EC50 范围为 10 到 19 nM。
靶点	BRDs
IC50	10-19 nM(EC50)
体外研究	OTX015 抑制 BRD2，BRD3，和 BRD4 与 Ach4 的结合，IC50 的范围为 92 到 112 nM，并抑制各种人癌细胞系的生长，GI50 的范围为 60 到 200 nM。OTX015 导致 c-MYC 表达快速下调，并且在 ALKpos ALCL 细胞系中，表现出与 ALK 抑制剂结合的协同抗增殖作用。
体内研究	OTX015(口服)显著抑制 Ty82 BRD-NUT 中线癌肿瘤在裸鼠体内的生长，100 毫克/千克 qd 下能够抑制 79%，10 毫克/千克下抑制 61%。
特征	口服生物可利用的 BRD2/3/4 选择性抑制剂，处于临床 I 期临床试验，用于治疗血液学恶性肿瘤。

美仑相关产品推荐

MB4243

RVX-208(RVX 000222)

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。OTX-015 是一种新的有效 BRD 抑制剂，在代表成熟 B 细胞肿瘤的几种细胞系中具有明显的抗增殖活性。可作为相关领域的科研试剂。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.0326 mL	10.1628 mL	20.3256 mL
5 mM		0.4065 mL	2.0326 mL	4.0651 mL
10 mM		0.2033 mL	1.0163 mL	2.0326 mL
50 mM		0.0407 mL	0.2033 mL	0.4065 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	TR-FRET 试验: 为了评估 OTX015 与 BRD2, BRD3, 以及 BRD4 的结合, BRD 表达的 CHO 细胞裂解物(来自感染表达质粒的 CHO 细胞, Flag 标记的 BRD2, BRD3, 或 BRD4 或仅载体), 辅共轭的抗 Flag 抗体, XL-665 共轭的链霉亲和素, 和生物素化的 OTX015 在室温下培育 0.2 到 2 小时。荧光性通过 TR-FRET 使用 EnVision 2103 多标阅读器测量, 结合的 EC50 使用 5.02 版 PRISM 通过非线性回归计算。
细胞实验：	Cell lines: 人肿瘤细胞 Concentrations: ~2 μM Incubation Time: 72 小时 Method: OTX015 对癌细胞增殖的作用通过将人肿瘤细胞在逐渐增加浓度的 OTX015 下培育 72 小时进行评估, 并使用基于四唑盐(WST-8)的比色测定评估。
动物实验：	Animal Models: Ty82 BRD-NUT 中线肿瘤异种移植的 BLAB/c-nu/nu 小鼠。 Formulation: -- Dosages: ~100 毫克/千克 Administration: 口服

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。