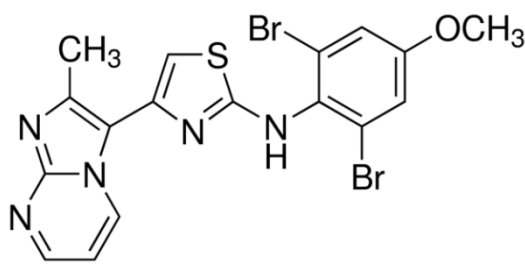


PTC-209 ; PTC-209

产品编号：MB3464
质量标准：>98%,BR
包装规格：5MG;25MG
产品形式：powder

基本信息

分子式	C17H13Br2N5OS	结 构 式	
分子量	495.19		
CAS No.	315704-66-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 99 mg/mL (199.92 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : Insoluble		
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：PTC-209 是一种特异性的 BMI-1 抑制剂，IC₅₀ 为 0.5 μM。

别名：N-(2,6-Dibromo-4-methoxyphenyl)-4-(2-methylimidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-2-thiazolamine

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 99 mg/mL (199.92 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PTC-209 是一种有效的选择性 BMI-1 抑制剂，在 HEK293T 细胞系中 IC ₅₀ 为 0.5 μM，并导致癌症起始细胞(CICs)的不可逆减少。
特性	BMI-1 选择性抑制剂，以 BMI-1 自我更新机制为靶点。
靶点	BMI-1 (HEK293T cells) 0.5 μM
体外研究	在人类结肠直肠的 HCT116 和人纤维肉瘤 HT1080 肿瘤细胞中，PTC-209 抑制 UTR 介导的报告基因和内源性 BMI-1 的表达。PTC-209 以 BMI-1 依赖性减少直肠肿瘤细胞的生长。此外，PTC-209 通过对不可逆生长的抑制来损伤肿瘤起始细胞。
体内研究	在原代人类结肠癌异种移植、人类结肠癌细胞系 LIM1215 或 HCT116 异种移植的小鼠体内，PTC-209 (60 mg/kg/day, s.c.)能够有效抑制肿瘤组织中 BMI-1 的产生，并且使已经生成的肿瘤细胞停止生长。PTC-209 也能降低体内功能性的结肠癌 CICs 的频率。

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。PTC-209 抑制癌基因 BMI-1 (B 淋巴瘤 Mo-MLV 插入区域 1 同源物)的表达，该基因编码参与细胞周期的多梳群无名指蛋白。PTC-209

降低了结直肠癌启动细胞(CICs)的自我更新特性, 该化合物抑制肿瘤生长, 降低了小鼠结肠癌肿瘤异种移植中 CICs 的表达水平。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.0194 mL	10.0971 mL	20.1943 mL
5 mM		0.4039 mL	2.0194 mL	4.0389 mL
10 mM		0.2019 mL	1.0097 mL	2.0194 mL
50 mM		0.0404 mL	0.2019 mL	0.4039 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	非编码区介导的荧光素酶报告基因的表达： HEK293 细胞用 GEMS 报告载体进行转染, GEMS 报告载体转染包含侧翼荧光素酶开放阅读框和 BMI-1 5'和 3' UTRs 转录后调控。得到的稳定细胞 (F8), 用 PTC-209 或载体对照处理过夜, 然后荧光素酶报告基因活性通过 Bright-Glo 测定法来确定。该测定以一式三份在各点运行, 抑制百分比通过与载体对照组比较计算得出。
细胞实验：	Cell lines: 人类淋巴瘤 U937 和 HT1080 肿瘤细胞, 原代人类外周血单核细胞和人类造血干细胞。 Concentrations: ~10 μ M Incubation Time: 4 天 Method: 为确定用抑制剂预处理是否会影响肿瘤细胞的生长, 细胞在抑制剂存在下被接种于体外培养 4 天, 再以限制剂量接种于体外而不进一步添加抑制剂。使用台盼蓝排除法来计数活细胞。体外细胞群生成的速率在抑制剂处理后通过评估包含细胞群的孔数量来进行计算。对 LDAs 建立后 PTC-209 处理过的细胞的恢复实验, 将其接种于 6 孔板, 每孔 1E6 个细胞, 并培养过夜。细胞随后以一式三份分别用 DMSO 载体或 PTC-209 (0.01, 0.1, 1 以及 10 μ M)处理 4 天。洗掉用于处理的药物, 所有孔中加入 4 毫升新鲜混悬介质。4 天处理干扰后, 进行细胞活性评估, 细胞用胰蛋白酶处理, 并且分别在移除药物 0, 24, 72 以及 120 小时后计数细胞数。药物处理对细胞群形成能力的长期持久影响通过接种 LDAs (50,000, 10,000, 1,000, 100, 10 以及 1 个细胞每孔)以药物处理 4 天, 在 120 小时后得到的细胞进行评估。
动物实验：	Animal Models: 原代人类结肠癌异种移植、人类结肠癌细胞系 LIM1215 和 HCT116 异种移植的裸鼠。 Formulation: 14%的 DMSO, 36%聚乙二醇 400 和 50%的聚丙二醇。 Dosages: ~60 毫克/千克/天 Administration: s.c.

【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。