

P5091 (P005091)

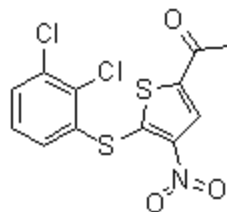
产品编号：MB3660

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C12H7Cl2NO3S2	结 构 式	
分子量	348.22		
CAS No.	882257-11-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO：28 mg/mL (80.4 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：P005091 是一种有效的，选择性的泛素特异性蛋白酶 7 (USP7) 抑制剂，EC₅₀ 值为 4.2 μM。

别名：P5091；1-[5-[(2,3-Dichlorophenyl)thio]-4-nitro-2-thienyl]-ethanone;

1-[5-(2,3-dichlorophenyl)sulfany]-4-nitro-2-thienyl]ethanone

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：28 mg/mL (80.4 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	P5091 (P005091)是一种选择性的，有效的 ubiquitin-specific protease 7 (USP7) (泛素特异性蛋白酶 7) 抑制剂，EC ₅₀ 为 4.2 μM，与作用于 USP47 相似。	
靶点	USP7 (Cell-free assay)	USP47 (Cell-free assay)
	4.2 μM(EC ₅₀)	4.3 μM
体外研究	P5091 是一种三取代噻吩，具有二氯苯硫基，硝基和乙酰基三种取代基，介导抗 USP7 活性。P5091 作用于 USP7，具有有效的，特异性的，选择性的去泛素化酶活性。相反，P5091 不抑制其他 DUBs 和其他家族半胱氨酸蛋白酶 (EC ₅₀ > 100 mM)。P5091 抑制具有 HA-UbVME 标签的 USP7，这种作用具有浓度依赖性。P5091 抑制 USP7 介导的超高分子量泛素链的裂解，这种作用存在剂量依赖性。而且，P5091 抑制 USP7-而非 USP2-或 USP8 介导的-聚 K48 连接的泛素链的裂解。P5091 抑制 USP7，诱导 HDM2 多泛素化，且加速 HDM2 降解。P5091 作用于 MM 细胞，抑制 USP7 去泛素化酶活性，不抑制蛋白酶活性。P5091 抑制 MM 细胞生长，克服抗 Bortezomib 性。P5091 诱导多种 MM 细胞系生存力降低，这种作用具有剂量依赖性，包括那些抗 常规疗法	

	Dexamethasone (Dex) (MM.1R), Doxorubicin (Dox-40), 或 Melphalan (LR5) (IC50 为 6-14 μ M)的耐药性。P5091 克服骨髓间充质干细胞诱导的 MM 细胞生长。P5091 降低 HDM2 和 HDMX , 上调 p53 和 p21 水平。总体而言 ,P5091-诱导的细胞毒性部分是通过 HDM2-p21 信号轴介导的 , 虽然 P5091 处理后 , p53 得到上调, 但 P5091 的细胞毒活性是不依赖于 p53 的。
体内研究	P5091 作用于动物肿瘤模型 ,耐受性好 ,抑制肿瘤生长 ,且延长动物寿命。P5091 与 Lenalidomide, HDAC 抑制剂 SAHA, 或 Dexamethasone 联用, 触发协同的抗 MM 活性。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4183	ML323
MB3664	P22077

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。P5091 是一种细胞通透性强的去泛素化酶 USP7(泛素特异性蛋白酶-7)的特异性抑制剂, 可诱导 HDM2 的多聚并加速 HDM2 的降解。P5091 可诱导耐传统和硼替佐米治疗的 MM 细胞凋亡。P5091 抑制肿瘤生长 ,延长肿瘤动物模型的存活时间。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8717 mL	14.3587 mL	28.7175 mL
5 mM	0.5743 mL	2.8717 mL	5.7435 mL
10 mM	0.2872 mL	1.4359 mL	2.8717 mL
50 mM	0.0574 mL	0.2872 mL	0.5743 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验 :	Animal Models: CB-17 SCID 小鼠 Formulation: 4% NMP (N-methyl-2-Pyrrolidone), 4% Tween-80, 和 92% Milli-Q 水 Dosages: 10 mg/kg Administration: --
--------	---

【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。