

PFI-1 (PF-6405761) ; PFI-1 (PF-6405761)

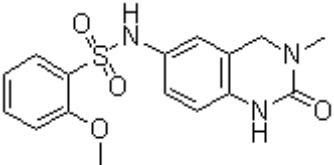
产品编号：MB3692

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	C16H17N3O4S	结构式	
分子量	347.39		
CAS No.	1403764-72-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO：69 mg/mL (198.62 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： PFI-1 是一种有效的 BET 抑制剂，能够有效抑制 BRD4，IC₅₀ 值为 0.22 μM。

别名： 2-Methoxy-N-(3-methyl-2-oxo-1,2,3,4-tetrahydro-quinazolin-6-yl)-benzenesulfonamide, PF-06405761

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：69 mg/mL (198.62 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	PFI-1 是一种具有高度选择性的 BET(包含溴结构域蛋白)抑制剂，作用于 BRD4 和 BRD2，无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 0.22 μM 和 98 nM。	
靶点	BRD2 (Cell-free assay) 98 nM	BRD4 (Cell-free assay) 0.22 μM
体外研究	PFI-1 与 cAMP 反应结合元件结合蛋白结合，K _D 为 49 μM。PFI-1 抑制从 LPS 刺激的人血单核细胞中产生 IL-6，EC ₅₀ 为 1.89 μM。PFI-1 作用于 T4302 CD133+ 细胞，诱导细胞活力降低，这种作用存在剂量依赖性。PFI-1 抑制三种 NET 细胞系增殖（胰腺 NET 衍生的 Bon-1 和肺 NET 衍生的 H727 和 H720）。	
体内研究	PFI-1 按 1 mg/kg 剂量静脉注射给药大鼠，分布体积为 1 L/kg，血浆清除率为 18/mL•min ⁻¹ •kg ⁻¹ ，半衰期为 1 小时。PFI-1 按 2 mg/kg 剂量口服给药大鼠，口服生物有效性低至 32%。PFI-1 按 2 mg/kg 剂量皮下注射给药小鼠，C _{max} 为 58 ng/mL，T _{max} 为 1 小时，	

半衰期约为 2 小时。

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)

MB3691	I-BET151 (GSK1210151A)
MB3315	OTX015
MB4419	PLX51107
MB3690	I-BET-762

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。人类 BET 家族包括 BRD2、BRD3、BRD4 和 BRDT,在基因转录调控中发挥重要作用。pfi1 是一种选择性 BET 溴域抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8786 mL	14.3930 mL	28.7861 mL
5 mM	0.5757 mL	2.8786 mL	5.7572 mL
10 mM	0.2879 mL	1.4393 mL	2.8786 mL
50 mM	0.0576 mL	0.2879 mL	0.5757 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验:	Cell lines: T4302 CD133+ 细胞 Concentrations: 1 mM Incubation Time: 5 天 Method: 为了测定剂量反应,细胞一式三份按每孔 5×10^3 的密度接种到 96 孔板中。加入 2 或 4 倍稀释的 PFI-1。接种 5 天后,使用 CellTiter-Glo 试剂盒测定细胞数,然后归一化到相应空白对照组。通过 GraphPad Prism 5 软件使用 4-parameter logistic 非线性回归模型测定 IC50 值。
动物实验:	Animal Models: 大鼠 Formulation: 生理盐水 Dosages: 1 mg/kg Administration: 静脉注射

【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。