

BS-181 HCl

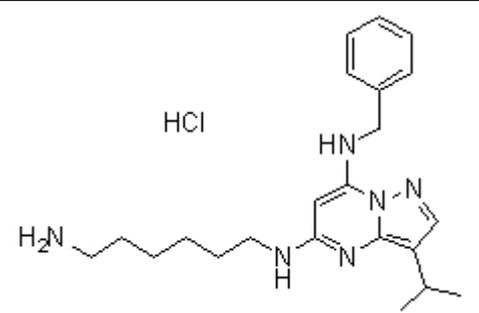
产品编号：MB4023

质量标准：>98%，CDK7 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₂ H ₃₂ N ₆ .HCl	结 构 式	
分子量	416.99		
CAS No.	1397219-81-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO 83 mg/mL (199.04 mM)		
	Water 3 mg/mL (7.19 mM)		
	Ethanol 22 mg/mL warmed (52.75 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：BS-181 盐酸盐是 CDK7 高效选择性抑制剂。

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO 83 mg/mL (199.04 mM) ; Water 3 mg/mL (7.19 mM) ; Ethanol 22 mg/mL warmed (52.75 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	BS-181 是高度选择性的 CDK7 抑制剂，IC ₅₀ 为 21 nM，作用于 CDK7 比作用于 CDK1, 2, 4, 5, 6, 和 9 选择性高 40 倍以上。
靶点	CDK7
IC₅₀	21 nM
体外研究	BS-181 是小分子 Cdk-激活激酶(CAK)抑制剂，在无细胞环境下，作用于 Cdk7 时，IC ₅₀ 为 21nM，Roscovitine 作用时，IC ₅₀ 为 510 nM，活性远低于 BS-181。BS-181 作用于 CDKs 和其他 69 种不同类型激酶，显示了对 CDK7 的高度选择性，浓度低于 1 μM 时抑制 CDK2，抑制效果比抑制 CDK7 低 35 倍，IC ₅₀ 为 880 nM，只稍微抑制 CDK1, CDK4, CDK5, CDK6 和 CDK9，IC ₅₀ 均大于 3.0 μM，高浓度(>10 μM) BS-181 只抑制少数其他种类激酶。BS-181 促进细胞周期停顿，且抑制多种类型癌细胞生长，包括乳腺癌，肺癌，前列腺癌，和卵巢癌，IC ₅₀ 为 11.5-37 μM。BS-181 作用于 MCF-7 细胞，抑制 CDK7 底物 RNA 聚合酶 II 羧基末端结构域(CTD)磷酸化，且促进细胞周期停顿和凋亡，从而抑制癌细胞系生长。
体内研究	BS-181 按 10 mg/kg 剂量腹腔注射给药小鼠，可清除血浆，半衰期为 405 分钟。BS-181 作用于携带 MCF-7 移植瘤的裸鼠模型，抑制肿瘤生长，这种作用存在剂量依赖性，每天按 10 mg/kg 和 20 mg/kg 剂量分别处理 2 周后，肿瘤生长分别降低 25% 和 50%，且没有明显毒性。

特征	BS-181 抑制 CDK7 比作用于其他 CDKs 及多种不同类型激酶的选择性高很多。
-----------	--

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)

MB4025	PHA-793887
MB4353	THZ1

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。BS-181 盐酸盐是 CDK7 高效选择性抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积	质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3981 mL	11.9907 mL	23.9814 mL
5 mM	0.4796 mL	2.3981 mL	4.7963 mL
10 mM	0.2398 mL	1.1991 mL	2.3981 mL
50 mM	0.0480 mL	0.2398 mL	0.4796 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	体外激酶抑制实验: 通过量不断提高的 BS-181 和纯化的重组 CDK7/CycH/MAT1 复合体进行温育测定抑制 CDK7 活性, 随后通过荧光素酶实验测定反应中残留的游离 ATP, 因此荧光素酶活性 提供了测量 CDK7 活性的手段, 可用于测定 IC50。
细胞实验	Cell lines: MCF-7 细胞 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为 50 μ M 左右 Incubation Time: 24 小时 Method: 用 BS-181 处理 MCF-7 细胞, 进行 24 小时。为了测定细胞周期和凋亡, 细胞用碘化丙啶染色, 或用膜联蛋白 V-FITC 标记, 通过使用 RXP cytomics 软件在 Beckman Coulter Elite ESP 上在 1 小时内获得标记细胞, 然后使用 Flow Jo v7.2.5 分析数据。为了测定 CDKs, 溶解细胞, 进行 Western Blotting 而分析。
动物实验	Animal Models: 携带 MCF-7 细胞的雌性 nu/nu-BALB/c 无胸腺裸鼠 Formulation: 10% DMSO/50 mM HCl/5% Tween-20/85% 盐水 Dosages: 10 或 20 mg/kg Administration: 腹腔注射, 每天两次

【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,使产品沉降到管底。对于液体产品,可以在 200 转左右稍作离心,管底收集液体,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。