

PTC-209 HBr

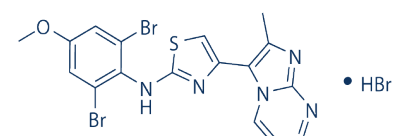
产品编号：MB4131

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C17H14Br3N5OS	结 构 式	
分子量	576.10		
CAS No.	1217022-63-3		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL warmed (173.58 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 氢溴酸盐是特异的 BMI-1 抑制剂。

别名：2-Thiazolamine, N-(2,6-dibromo-4-methoxyphenyl)-4-(2-methylimidazo[1,2-a]pyrimidin-3-yl)-, hydrobromide

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL warmed (173.58 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

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	PTC-209 HBr 是 PTC-209 的氢溴酸盐，这是一种强效的选择性的 BMI-1 抑制剂，其 IC50 为 0.5 μM，可以不可逆的减少癌起始细胞(CICs)。
特性	BMI-1-选择性抑制剂，以 BMI-1 自我复制机制为靶点。
靶点	BMI-1

	0.5 μ M
体外研究	PTC-209 抑制人结肠直肠 HCT116 和人纤维肉瘤 HT1080 肿瘤细胞中 UTR 介导的报告基因表达和内源性 BMI-1 表达。PTC-209 以 BMI-1 依赖的方式减少结肠癌肿瘤细胞的生长。此外，PTC-209 通过不可逆生长抑制损害结肠直肠癌起始细胞(CICs)。
体内研究	在原代人结肠癌异种移植，人结肠癌细胞系 LIM1215 或 HCT116 异种移植的小鼠体内，PTC-209 (60 毫克/千克/天，皮下注射)有效抑制肿瘤组织中 BMI-1 产生，并使已产生的肿瘤停止生长。PTC-209 也会减少体内功能性结直肠癌 CICs 的频率。

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)

MB3464	PTC-209
--------	---------

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 氢溴酸盐是特异的 BMI-1 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	1.7358 mL	8.6790 mL	17.3581 mL
5 mM	0.3472 mL	1.7358 mL	3.4716 mL
10 mM	0.1736 mL	0.8679 mL	1.7358 mL
50 mM	0.0347 mL	0.1736 mL	0.3472 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>非翻译区介导的荧光素酶报告基因表达: HEK293 细胞用包含荧光素酶两侧开放阅读框和转录后调控下的 BMI-1 5' 和 3' UTRs 的 GEMS 报告载体转染。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的活性通过 Bright-Glo 测定法确定。试验中每个点重复测定三次，抑制的百分数通过载体对照计算。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: 人淋巴瘤 U937 和 HT1080 肿瘤细胞，原代人外周血单个核细胞和人造血干细胞。</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 4 天</p> <p>Method: 为确定用抑制剂处理是否影响肿瘤细胞的生长，将细胞与抑制剂在体外接种培养 4 天，再以限制剂量且不进一步添加抑制剂在体外接种。使用台盼蓝排除法计数活细胞。体外球体起始细胞频率在抑制剂处理后计算，通过估计含有球体的孔数量。对于实验，建立</p>

	LDAs, 随后 PTC-209 处理的细胞恢复, 1E6 个细胞每孔接种于 6 孔板, 培养过夜。然后细胞以一式三份分别用 DMSO 载体或 PTC-209 (0.01, 0.1, 1 和 10 μ M)处理 4 天。洗掉用于处理的药物, 将 4 毫升新鲜混悬介质加入到孔中。为评估处理 4 天后的细胞活性, 细胞被胰蛋白酶化, 在除去药物 0, 24, 72 和 120 小时后进行计数。药物处理对球体形成能力的长期影响使用药物处理 4 天后 120 小时所得到的细胞通过接种 LDAs (50,000, 10,000, 1,000, 100, 10 和 1 个细胞每孔)评估。
动物实验	<p>Animal Models: 原代人结肠癌异种移植, 人结肠癌细胞系 LIM1215 和 HCT116 异种移植的裸鼠模型。</p> <p>Formulation: 14% DMSO, 36% 聚乙二醇 400 和 50% 聚丙二醇。</p> <p>Dosages: ~60 毫克/千克/天</p> <p>Administration: 皮下注射</p>

【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, 否则会严重影响化合物活性, 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(M ²)	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。