

RVX-208 ; RVX 000222

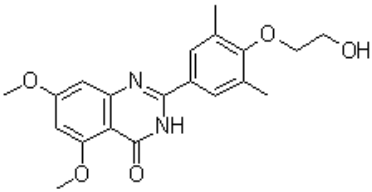
产品编号 : MB4243

质量标准 : >98%, BET bromodomain 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₂₂ N ₂ O ₅	结 构 式	
分子量	370.4		
CAS No.	1044870-39-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 74 mg/mL (199.78 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 : RVX-208 是一种 BET 转录抑制剂, 作用于 BD1 和 BD2。

别名 : Apabetalone; 阿帕他隆 ; RVX000222 ; 4(3H)-Quinazolinone, 2-[4-(2-hydroxyethoxy)-3,5-dimethylphenyl]-5,7-dimethoxy

物理性状及指标 :

外观 :白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 74 mg/mL (199.78 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	RVX-208 是一种有效的 BET bromodomain 抑制剂, 作用于 BD2, 无细胞试验中 IC ₅₀ 为 0.510 μM, 比作用于 BD1 选择性高 170 倍。
靶点	BD2
IC₅₀	0.51 μM

体外研究	作为 BET 溴结构域蛋白抑制剂，RVX-208 优先与基于 BET 蛋白质的第二溴结构域蛋白结合。RVX-208，作为载脂蛋白(APO) AI 基因表达的激动剂，在体外增加 apoA-I 和 HDL-C。
体内研究	RVX-208 显著增加 AGMs 中血清 apoA-I 和 HDL-C，并通过不同途径增加胆固醇流出。
特征	首创新药 BD2 选择性 BET 溴结构域蛋白抑制剂在 II 期临床试验中进行测试，用于冠状动脉综合症和动脉粥样硬化的治疗。

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)

MB3315	OTX015
--------	--------

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。RVX-208 是一种 BET 转录抑制剂，作用于 BD1 和 BD2。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6998 mL	13.4989 mL	26.9978 mL
5 mM	0.5400 mL	2.6998 mL	5.3996 mL
10 mM	0.2700 mL	1.3499 mL	2.6998 mL
50 mM	0.0540 mL	0.2700 mL	0.5400 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	<p>Animal Models: 天然成年雄性 AGMs</p> <p>Formulation: 1N 盐酸盐和羧甲基纤维素</p> <p>Dosages: ~60 毫克/千克</p> <p>Administration: 口服灌胃或静脉注射</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。