

PLX51107

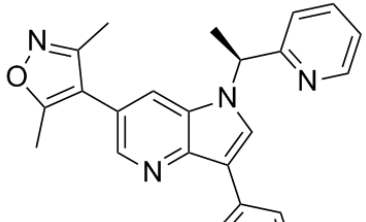
产品编号：MB4419

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG；25MG

产品形式：白色至类白色固体

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₂₂ N ₄ O ₃	结 构 式	
分子量	438.48		
CAS No.	1627929-55-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性	DMSO: 83.3 mg/mL (Need warming)		
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：PLX51107 是一种有效的，选择性的 **BET** 抑制剂，对 BRD2，BRD3，BRD4 和 BRDT 的 BD1 结构域的亲和力 K_d 值分别为 1.6，2.1，1.7 和 5 nM，BD2 结构域亲和力 K_d 值分别为 5.9，6.2，6.1 和 120 nM；PLX51107 同时与 CBP 和 EP300 的结构域相互作用 (K_d ，~ 100 nM)。

别名：Benzoic acid,

4-[6-(3,5-dimethyl-4-isoxazolyl)-1-[(1S)-1-(2-pyridinyl)ethyl]-1H-pyrrolo[3,2-b]pyridin-3-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO: 83.3 mg/mL (Need warming)；

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

溴代和外源性 (BET) 家族蛋白是癌症基因表达的关键调控因子。在这里，我们利用 BRD4 谱分析，以确定关键途径参与慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 的发病机制。BRD4 在 CLL 中过表达，在 CLL 中富集或上调基因表达，在疾病的发病机制和进展中具有已知的功能。这些基因，包括 B 细胞受体 (BCR) 信号通路的关键成员，提供了这种治疗方法的理论基础，以识别替代类型癌症的新靶点。预防某些促生长基因的表达可导致 BRD4 过表达肿瘤细胞中的凋亡诱导和增殖抑制。BRD4 是人类溴代素和额外末端蛋白 (BET) 家族的成员，是在某些肿瘤细胞中过表达的转录调节因子，在细胞增殖中起重要作用。

产品描述	PLX51107 是一种有效的，选择性的 BET 抑制剂，对 BRD2，BRD3，BRD4 和 BRDT 的 BD1 结构域的亲和力 K_d 值分别为 1.6，2.1，1.7 和 5 nM，BD2 结构域亲和力 K_d 值分别为 5.9，6.2，6.1 和 120 nM；PLX51107 同时与 CBP 和 EP300 的结构域相互作用 (K_d ，~ 100 nM)。
靶点	Kd: 1.6 nM (BRD2-BD1), 2.1 nM (BRD3-BD1), 1.7 nM (BRD4-BD1), 5 nM (BRDT-BD1), 5.9 nM (BRD2-BD2), 6.2 nM (BRD3-BD2), 6.1 nM (BRD4-BD2), 120 nM (BRDT-BD2), ~100 nM (CBP), ~100 nM (EP300)
体外研究	PLX51107 是一种有效的选择性 BET 抑制剂，BD1 的 Kds 分别为 1.6,2.1,1.7 和 5 nM，BRD2，BRD3，BRD4 和 BRDT 的 BD2 分别为 5.9,6.2,6.1 和 120 nM。 PLX51107 还与 CBP 和 EP300

	的溴结构域相互作用 (Kd, 在 100nM 范围内)。 PLX51107 (0.156-10 μ M) 抑制 CpG 诱导的原发性慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 细胞的增殖。 PLX51107 还导致 p21 和 I κ B α 的积累, 降低 c-MYC 水平, 并调节促凋亡蛋白和抗凋亡蛋白。 PLX51107 选择性地调节 CLL 驱动基因。
体内研究	PLX51107 (2mg / kg, 口服) 在 Ba / F3 (鼠 IL3 依赖性 pro-B 细胞系) 脾肿大小鼠模型中抑制 75% 的脾肿大, 具有 25mg / kg OTX015 的类似作用。 PLX51107 (20mg / kg, qd, p.o.) 在侵袭性慢性淋巴细胞白血病 (CLL) 和里氏转化 (RT) 的疾病模型中通过每日一次口服施用显示出有效的抗白血病作用。

美仑相关产品推荐

MB3315	OTX015
MB4243	RVX-208(RVX 000222)

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。 PLX51107 是一种有效的选择性 BRD4 抑制剂或 BET 抑制剂, 具有新颖的体内外药理特性, 可在 CLL 的临床前模型中模拟或超过 BCR 信号转导剂的疗效。 PLX51107 与 BRD4 蛋白溴域中乙酰化的赖氨酸识别基序结合, 从而防止 BRD4 与组蛋白上乙酰化的赖氨酸结合。 这会破坏染色质重塑和基因表达。 有研究显示 PLX51107 可抗白血病作用, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置 :

体 DMSO 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.2806 mL	11.4030 mL	22.8061 mL
5 mM		0.4561 mL	2.2806 mL	4.5612 mL
10 mM		0.2281 mL	1.1403 mL	2.2806 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	PLX51107 配制在 10%N-甲基-2-吡咯烷酮加稀释剂 (40%PEG400,5%TPGS, 5%Poloxamer407 和 50%水) 中。 小鼠 对于植入研究, 通过尾静脉注射源自具有活动性疾病的 E μ -TCL1 或 E μ -Myc / TCL1 小鼠的脾细胞, 使 C57BL / 6WT 小鼠移植 1E7 细胞。 在白血病发作时 (E μ -TCL1 : \geq 10%CD19 / CD5 / CD45 阳性循环细胞; E μ -Myc / TCL1 : WBC 计数 \geq 8 和/或 \geq 5%CD19 / CD5 / CD45 阳性循环细胞), 将小鼠随机分组以接受所示的治疗。 PLX51107 20 mg / kg, qd (每日一次), 口服强饲。 载体 = 10% N-甲基-2-吡咯烷酮加稀释剂 (40%PEG400,5%TPGS, 5%Poloxamer407 和 50%水)。 当满足早期去除标准 (> 20%体重减轻, 运动受损, 脾肿大和明显肿瘤块) 时, 处死小鼠, 并收集组织用于进一步分析。
-------------	--

【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。