

(+)-JQ1

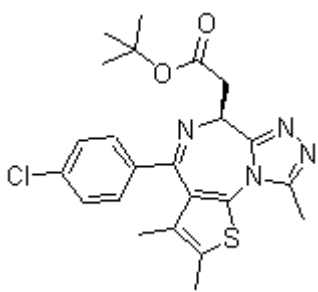
产品编号: MB7243

质量标准: >98%

包装规格: 5MG;25MG;100MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C23H25ClN4O2S	结 构 式	
分子量	456.99		
CAS No.	1268524-70-4		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 91 mg/mL warmed (199.12 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 91 mg/mL (199.12 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: (+)-JQ-1 是一种 BET bromodomain 抑制剂。

别名: JQ1; 6H-Thieno[3,2-f][1,2,4]triazolo[4,3-a][1,4]diazepine-6-acetic acid, 4-(4-chlorophenyl)-2,3,9-trimethyl-, 1,1- dimethylethyl ester, (6S)-

物理性状及指标:

外观:白色或淡黄色粉末

溶解性:DMSO: 91 mg/mL warmed (199.12 mM); Water Insoluble; Ethanol: 91 mg/mL (199.12 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	(+)-JQ1 是一种 BET bromodomain 抑制剂, 作用于 BRD4(1/2), 无细胞试验中 IC50 为 77 nM/33 nM, 结合到 BET 家族的所有溴结构域, 而不结合到 BET 家族以外的溴结构域。	
特性	(+)-JQ1 比(-)-JQ1 更有效。	
靶点	BRD4 (2) (Cell-free assay) 33 nM	BRD4 (1) (Cell-free assay) 77 nM
体外研究	(+)-JQ1 对映体直接结合到 BET bromodomain 结构域的 Kac 结合位点。(+) -JQ1(500 nM)与染色质竞争性结合到 BRD4, 导致 NMC 细胞分化和生长停滞。通过 Ki67 染色减少, 证明了(+)-JQ1(500 nM)减弱 NMC 797 和 Per403 细胞系的快速增殖。(+) -JQ1(500 nM)作用于 NMC 797 细胞, 有效降低 BRD4 靶基因的表达。(+) -JQ1 作用于 NMC 11060 细胞, 抑制细胞活力, IC50 为 4 nM。(+) -JQ1 作用于 MM 细胞系, 强抑制 MYC 表达。(+) -JQ1 抑制 KMS-34 和 LR5 增殖, IC50 分别为 68 nM 和 98 nM。(+) -JQ1(500 nM)处理 MM.1S 细胞, 导致 S 期细胞比例明显下降, 随之细	

	<p>胞停滞在 G0/G1 期增多。(+)JQ1(500 nM)通过 β-半乳糖苷酶染色, 导致明显的细胞衰老。(+)JQ1(800 nM)处理 CD138+病患衍生的 MM 样本, 显著降低细胞活力。(+)JQ1 抑制 LP-1 细胞生长, GI50 为 98 nM。(+)JQ1(625 nM)导致 LP-1 细胞在 G0/G1 期的百分数增高。(+)JQ1(500 nM)作用于 LP-1 细胞, 抑制 MYC, BRD4 和 CDK9 表达。(+)JQ1(1 μM)处理潜伏感染的 Jurkat T 细胞, 激活 HIV 转录。(+)JQ1(50 μM)作用于 Jurkat 和 HeLa 细胞, 主要刺激 Tat 依赖性的 HIV 转录。(+)JQ1(5 μM)作用于 J-Lat A2 细胞, 诱导 Brd4 解离, 从而使 Tat 招募 SEC 到 HIV 启动子上, 诱导 Pol II CTD 磷酸化和病毒转录。</p>
体内研究	<p>(+)JQ1(50 mg/kg)处理携带 NMC 797 移植瘤的小鼠, 抑制肿瘤生长。(+)JQ1(50 mg/kg) 抹除掉携带 NMC 797 移植瘤的小鼠的 NUT 核斑点, 与竞争性结合到核染色质相一致。(+)JQ1(50 mg/kg)处理 NMC 797 移植瘤, 显著诱导(31 级)角蛋白表达。(+)JQ1(50 mg/kg)处理携带 NMC 移植瘤的小鼠模型, 促进分化, 肿瘤衰退, 延长寿命。(+)JQ1(50 mg/kg)处理静脉注射 MM.1S-luc+细胞, 携带原位移植瘤的 SCID 米色小鼠, 与对照组动物相比, 显著延长小鼠的总生存期。(+)JQ1(50 mg/kg, 腹腔注射)处理携带 Raji 移植瘤的小鼠, 显著提高小鼠寿命。</p>

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
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。本品(+)JQ-1 是一种 BET bromodomain 抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.1882 mL	10.9412 mL	21.8823 mL
5 mM		0.4376 mL	2.1882 mL	4.3765 mL
10 mM		0.2188 mL	1.0941 mL	2.1882 mL
50 mM		0.0438 mL	0.2188 mL	0.4376 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: MC 11060 细胞 Concentrations: ~500 nM Incubation Time: 48 小时 Method: 细胞按每孔 500 个接种在白色, 384 孔微孔板, 孔中含总体为 50 μL 的培养基。797, TT 和 TE10 细胞生长在含 1% Penicillin/Streptomycin 和 10% FBS 的 DMEM 培养基上。Per403 细胞生长在含 1% Penicillin/Streptomycin 和 20% FBS 的 DMEM 培养基上。病患衍生的 NMC 11060 细胞生长在含 10% FBS 和 1% Penicillin/Streptomycin 的 RPMI 培养基上。通过自动化针转移机将(+)JQ1 置于微量检测板上。使细胞裂解, 通过增殖试验测评孔中的总 ATP 含量。根据剂量, 重复测量分析, 通过逻辑回归 (GraphPad Prism) 计算 IC50。</p>
------	--

动物实验	<p>Animal Models: 携带 NMC 797 移植瘤的小鼠</p> <p>Formulation: 5% DMSO 溶于 5% 葡萄糖</p> <p>Dosages: 50 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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(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。