

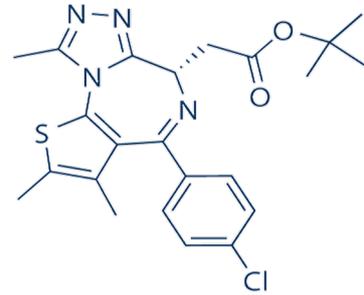
(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0002-10mM	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0002-5mg	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	5mg
SC0002-25mg	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	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)-
简称	(+)-JQ1
别名	(+)-JQ-1, JQ-1, JQ1, Bromodomain inhibitor
中文名	N/A
化学式	C ₂₃ H ₂₅ ClN ₄ O ₂ S
分子量	456.99
CAS号	1268524-70-4
纯度	100.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 91mg/ml; Ethanol 91mg/ml
溶液配制	5mg加入1.09ml DMSO, 或者每4.57mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0002-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

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IC ₅₀ 为77nM/33nM,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。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	BRD4(1)	BRD4(2)	—	—	—
IC ₅₀	77nM	33nM	—	—	—
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(500nM)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(500nM)减弱NMC797和Per403细胞系的快速增殖。(+) -JQ1(500nM)作用于NMC797细胞,有效降低BRD4靶基因的表达。(+) -JQ1作用于NMC11060细胞,抑制细胞活力,IC ₅₀ 为4nM。(+) -JQ1作用于MM细胞系,强抑制MYC表达。(+) -JQ1抑制KMS-34和LR5增殖,IC ₅₀ 分别为68nM和98nM。(+) -JQ1(500nM)处理MM.1S细胞,导致S期细胞比例明显下降,随之细胞停滞在G ₀ /G ₁ 期增多。(+) -JQ1(500nM)通过β-半乳糖苷酶染色,导致明显的细胞衰老。(+) -JQ1(800nM)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,GI ₅₀ 为98nM。(+) -JQ1(625nM)导致LP-1细胞在G ₀ /G ₁ 期的百分数增高。(+) -JQ1(500nM)作用于LP-1细胞,抑制MYC, BRD4和CDK9表达。(+) -JQ1(1μM)处理潜伏感染的Jurkat T细胞,激活HIV转录。(+) -JQ1(50μM)作用于Jurkat和HeLa细胞,主要刺激Tat依赖性的HIV转录。(+) -JQ1(5μM)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PolII CTD磷酸化和病毒转录。				
体内研究	(+)-JQ1(50mg/kg)处理携带NMC797移植瘤的小鼠,抑制肿瘤生长。(+) -JQ1(50mg/kg) 抹除掉携带NMC797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(50mg/kg)处理NMC 797移植瘤,显著诱导(31级)角蛋白表达。(+) -JQ1(50mg/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(50mg/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(50mg/kg,腹腔注射)处理携带Raji移植瘤的小鼠,显著提高小鼠寿命。				
临床实验	N/A				
特征	(+) -JQ1比(-)-JQ1更有效。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献,碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	MC11060 细胞
浓度	~500nM
处理时间	48 小时
方法	细胞按每孔 500 个接种在白色, 384 孔微孔板, 孔中含总体为 50 μ l 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 NMC11060 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。

动物实验	
动物模型	携带 NMC797 移植瘤的小鼠
配制	5% DMSO 溶于 5%葡萄糖
剂量	50mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ 参考文献:

1. Filippakopoulos P, et al. Nature. 2010; 468(7327):1067-1073.
2. Delmore JE, et al. Cell. 2011; 146(6):904-917.
3. Mertz JA, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 2011; 108(40):16669-16674.
4. Li Z, et al. Nucleic Acids Res. 2013; 41(1):277-287.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0002-10mM	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC0002-5mg	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	5mg
SC0002-25mg	(+)-JQ1 (BRD4抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存, 至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页: <http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.12.12