

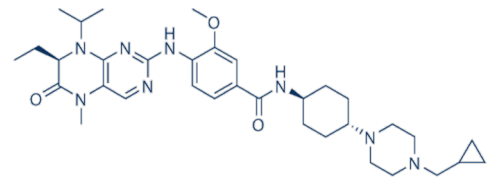
Volasertib (PLK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6614-10mM	Volasertib (PLK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6614-5mg	Volasertib (PLK抑制剂)	5mg
SC6614-25mg	Volasertib (PLK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[4-[4-(cyclopropylmethyl)piperazin-1-yl]cyclohexyl]-4-[[[(7R)-7-ethyl-5-methyl-6-oxo-8-propan-2-yl-7H-pteridin-2-yl]amino]-3-methoxybenzamide
简称	Volasertib
别名	BI6727, BI 6727, BI-6727
中文名	N/A
化学式	C ₃₄ H ₅₀ N ₈ O ₃
分子量	618.81
CAS号	755038-65-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 20mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.81ml DMSO, 或每6.19mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6614-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Volasertib (BI 6727)是一种高度有效的Plk1抑制剂, 无细胞试验中IC50为0.87nM, 比作用于Plk2和Plk3选择性高6和65倍。Phase 3。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	PLK1	—	—	—	—
IC50	0.87nM	—	—	—	—
体外研究	BI6727显著抑制多种人类肿瘤异种植物的生长, 包括HCT116、NCI-H460和紫杉类耐药CXB1结肠癌, 伴随着增加的有丝分裂指数以及细胞凋亡的增加。体内研究表明, BI6727表现出比BI2536更好的毒性和药理学特征。				
体内研究	BI6727具有高的体积分布, 良好的组织穿透力和长的半衰期。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	重组人类Plk1的(残基1-603)是用杆状病毒表达系统表达的带有NH2末端和GST-标记的融合采用的蛋白质。酶的活性测定法测定Plk1是在梯度稀释的BI6727中进行, 以20ng重组激酶以及10μg牛乳酪蛋白为底物。激酶反应在60微升的终体积在30°C下进行45分钟[15mM MgCl ₂ , 25mM MOPS(pH 7.0), 1mM DTT, 1% DMSO, 7.5μM ATP, 0.3μCi γ-32P-ATP]。反应通过加入125μl冰冷的5%三氯乙酸终止。转移沉淀到多屏幕混合酯纤维素过滤板后, 洗涤板用1%三氯乙酸洗涤并测量辐射量。剂量-反应曲线用于计算IC50值。

细胞实验	
细胞系	HCT116, NCI-H460, BRO, GRANTA-519, HL-60, THP-1和Raji细胞
浓度	溶解在DMSO中至终浓度约1μM
处理时间	24、48和72小时
方法	细胞增殖测定是将细胞孵育在不同浓度的BI6727中24、48和72小时, 而后在荧光分光光度计上通过测量的Alamar蓝染料的转换测定。有效浓度在哪些细胞生长是由50% (EC 50)抑制从剂量- 反应曲线拟合推断

	的。为了确定DNA含量，细胞悬浮液被固定在80%乙醇中，用含0.25%Triton X-100的PBS处理5分钟，并用含0.1%RNA酶和10µg/ml的碘化丙锭的PBS室温孵育20分钟。细胞周期的测定是用流式细胞仪分析的。
--	--

动物实验	
动物模型	雌性BomTac: NMRI-Foxn1 NU小鼠腹腔移植HCT116、NCI-H460或CXB1细胞。
配制	配制成盐酸(0.1N)，并用0.9%的NaCl稀释，或悬浮在0.5%的Natrosol250羟乙基纤维素。
剂量	约25mg/kg/day
给药方式	静脉注射，或通过灌胃针

➤ **参考文献:**

- 1.Rudolph D, et al. Clin Cancer Res, 2009, 15(9), 3094-3102.
- 2.Grinshtein N, et al. Cancer Res, 2011, 71(4), 1385-1395.
- 3.Harris PS, et al. BMC Cancer, 2012, 12, 80.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6614-10mM	Volasertib (PLK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6614-5mg	Volasertib (PLK抑制剂)	5mg
SC6614-25mg	Volasertib (PLK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01