

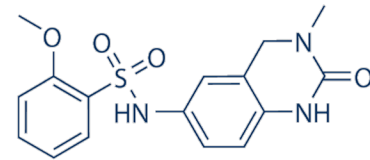
PFI-1 (BET抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1101-10mM	PFI-1 (BET抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1101-5mg	PFI-1 (BET抑制剂)	5mg
SD1101-25mg	PFI-1 (BET抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-methoxy-N-(3-methyl-2-oxo-1,4-dihydroquinazolin-6-yl)benzenesulfonamide
简称	PFI-1
别名	PF-6405761, QCR-192, GTPL7523, AOB2223
中文名	N/A
化学式	C ₁₆ H ₁₇ N ₃ O ₄ S
分子量	347.39
CAS号	1403764-72-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 69mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.44ml DMSO, 或每3.47mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1101-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	PFI-1是一种选择性BET(包含溴结构域蛋白)抑制剂, 作用于BRD4, 无细胞试验中IC ₅₀ 为0.22μM。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	BRD4	—	—	—	—
IC ₅₀	0.22μM	—	—	—	—
体外研究	PFI-1与cAMP反应结合元件结合蛋白结合, KD为49μM。PFI-1抑制从LPS刺激的人血单核细胞中产生IL-6, EC ₅₀ 为1.89μM。PFI-1作用于T4302 CD133 ⁺ 细胞, 诱导细胞活力降低, 这种作用存在剂量依赖性。PFI-1抑制三种NET细胞系增殖(胰腺NET衍生的Bon-1和肺NET衍生的H727和H720)。				
体内研究	PFI-1按1mg/kg剂量静脉注射给药大鼠, 分布体积为1L/kg, 血浆清除率为18/ml·min·kg, 半衰期为1小时。PFI-1按2mg/kg剂量口服给药大鼠, 口服生物有效性低至32%。PFI-1按2mg/kg剂量皮下注射给药小鼠, C _{max} 为58ng/ml, T _{max} 为1小时, 半衰期约为2小时。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	T4302 CD133 ⁺ 细胞
浓度	1mM
处理时间	5天
方法	为了测定剂量反应, 细胞一式三份按每孔5×10 ³ 的密度接种到96孔板中。加入2或4倍稀释的PFI-1。接种5天后, 使用CellTiter-Glo试剂盒测定细胞数, 然后归一化到相应空白对照组。通过GraphPad Prism 5软件使用4-parameter logistic非线性回归模型测定IC ₅₀ 值。

动物实验	
动物模型	大鼠
配制	生理盐水

剂量	1mg/kg
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

- 1.Fish PV, et al. J Med Chem, 2012, 55(22), 9831-9837.
- 2.Cheng Z, et al. Clin Cancer Res, 2013, 19(7), 1-12.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1101-10mM	PFI-1 (BET抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1101-5mg	PFI-1 (BET抑制剂)	5mg
SD1101-25mg	PFI-1 (BET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