



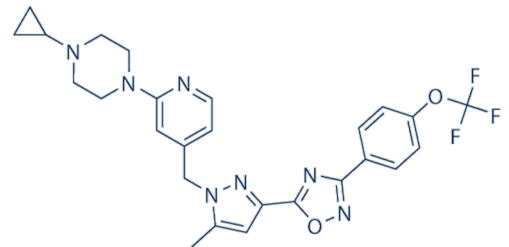
## BAY87-2243 (HIF抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1193-10mM	BAY87-2243 (HIF抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1193-5mg	BAY87-2243 (HIF抑制剂)	5mg
SC1193-25mg	BAY87-2243 (HIF抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	5-[1-[[2-(4-cyclopropylpiperazin-1-yl)pyridin-4-yl]methyl]-5-methylpyrazol-3-yl]-3-[4-(trifluoromethoxy)phenyl]-1,2,4-oxadiazole
简称	BAY87-2243
别名	BAY 87-2243, BAY872243, BAY 872243
中文名	N/A
化学式	C <sub>26</sub> H <sub>26</sub> F <sub>3</sub> N <sub>7</sub> O <sub>2</sub>
分子量	525.53
CAS号	1227158-85-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 6mg/ml; Ethanol 8mg/ml
溶液配制	5mg加入0.95ml DMSO, 或每5.26mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1193-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	BAY 87-2243是一种有效的选择性hypoxia-inducible factor-1 (HIF-1)抑制剂。Phase 1。				
信号通路	Angiogenesis; Epigenetics				
靶点	HIF-1	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	BAY87-2243抑制HIF-1的报道基因活性和CA9蛋白表达, IC50分别为0.7nM和2nM。在低氧肺癌H460细胞中, BAY87-2243抑制HIF靶点基因表达, 并抑制HIF-1α蛋白质积累。在葡萄糖消耗下, BAY87-2243通过干扰线粒体功能抑制细胞增殖。				
体内研究	在H460异种移植小鼠模型中, BAY87-2243(4毫克/千克, 口服)降低肿瘤重量, HIF-1α蛋白质, 以及HIF-1靶点基因表达水平。				
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	非小细胞肺癌(NSCLC)细胞系H460
浓度	10μM
处理时间	48小时
方法	为了评估BAY87-2243的细胞毒性, 各细胞系的2000个细胞接种于96孔板, 在含有10% FCS的适当培养基中培养。接种24小时后, 加入不同浓度的BAY 87-2243, 再培养48小时, 细胞活性使用细胞滴度发光法测定。

动物实验	
动物模型	负荷肺癌H460异种植物的小鼠
配制	1% (v/v) 乙醇溶液/solutol/水(10/40/50%)

剂量	~4毫克/千克/天
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

1.Ellinghaus P, et al. Cancer Med. 2013, 2(5), 611-624.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1193-10mM	BAY87-2243 (HIF抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1193-5mg	BAY87-2243 (HIF抑制剂)	5mg
SC1193-25mg	BAY87-2243 (HIF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:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，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