



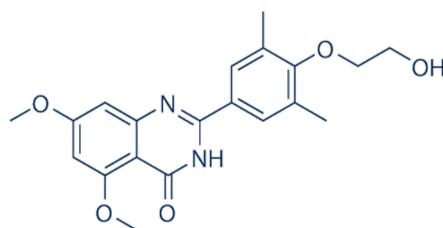
RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1159-10mM	RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1159-5mg	RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)	5mg
SD1159-25mg	RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-[4-(2-hydroxyethoxy)-3,5-dimethylphenyl]-5,7-dimethoxy-1H-quinazolin-4-one
简称	RVX-208
别名	RVX 000222, RVX 208, RVX-000222, RVX000222, RVX208
中文名	N/A
化学式	C ₂₀ H ₂₂ N ₂ O ₅
分子量	370.4
CAS号	1044870-39-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 74mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.35ml DMSO, 或每3.70mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1159-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	RVX-208是一种有效的BET bromodomain抑制剂, 作用于BD2, 无细胞试验中IC ₅₀ 为0.510μM, 比作用于BD1选择性高170倍。Phase 2。				
信号通路	Epigenetics				
靶点	BD2	—	—	—	—
IC ₅₀	0.51μM	—	—	—	—
体外研究	作为BET溴结构域蛋白抑制剂, RVX-208优先与基于BET蛋白质的第二溴结构域蛋白结合。RVX-208, 作为载脂蛋白(APO) AI基因表达的激动剂, 在体外增加apoA-I和HDL-C。				
体内研究	RVX-208显著增加AGMs中血清apoA-I和HDL-C, 并通过不同途径增加胆固醇流出。				
临床实验	N/A				
特征	首创新药BD2选择性BET溴结构域蛋白抑制剂在II期临床试验中进行测试, 用于冠状动脉综合症和动脉粥样硬化的治疗。				

➤ 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	实验使用AlphaScreen 680激发/570发射滤光片组在PHERAstar FS酶标仪上进行。对相应DMSO对照标准化后, IC ₅₀ 值在Prism 5中计算。测定根据稍加修改的生产商方案进行。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	天然成年雄性AGMs
配制	1N盐酸盐和羧甲基纤维素
剂量	~60毫克/千克
给药方式	口服灌胃或静脉注射

➤ 参考文献:

- 1.Picaud S, et al. Proc Natl Acad Sci USA. 2013, 110(49), 19754-19759.
- 2.McNeill E. Curr Opin Investig Drugs. 2010, 11(3), 357-364.
- 3.Bailey D, et al. J Am Coll Cardiol. 2010, 55(23), 2580-2589.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1159-10mM	RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1159-5mg	RVX-208 (BET bromodomain抑制剂)	5mg
SD1159-25mg	RVX-208 (BET bromodomain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