产品名称：**BRD73954**
产品别名：**BRD73954**

生物活性：

Description

BRD73954 ia a potent and selective HDAC inhibitor with IC50 of 36 nM and 120 nM for HDAC6 and HDAC8, respectively. IC50 value: 36 nM (HDAC6), 120 nM (HDAC8) Target: HDAC BRD73954 is the first small molecule histone deacetylase (HDAC) inhibitor, capable of potently and selectively inhibiting both HDAC6 and HDAC8, despite the fact that these isoforms belong to distinct phylogenetic classes within the HDAC family of enzymes. Our data demonstrate that meta substituents of phenyl hydroxamic acids are readily accommodated upon binding to HDAC6 and, furthermore, are necessary for the potent inhibition of HDAC8. At 10 ?M, BRD73954 treatment results in a robust increase in acetylation of α-tubulin, a known HDAC6 substrate, but not histone H3, a substrate for HDAC1, 2, and 3, in HeLa cells.

IC_{50} & Target

HDAC6	HDAC8	HDAC2
0.036 μM (IC_{50})	0.12 μM (IC_{50})	9 μM (IC_{50})

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : 25 mg/mL (87.93 mM; Need ultrasonic)

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	3.5173 mL	17.5864 mL	35.1729 mL
	5 mM	0.7035 mL	3.5173 mL	7.0346 mL
	10 mM	0.3517 mL	1.7586 mL	3.5173 mL

*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。

In Vivo:

请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 **In Vitro** 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：

——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。

源叶生物

	3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (8.79 mM，饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
References	[1]. Olson DE, et al. Discovery of the first histone deacetylase 6/8 dual inhibitors. J Med Chem. 2013 Jun 13;56(11):4816-4820.

源叶生物