产品名称：PFI-2 (hydrochloride)
产品别名：(R)-PFI-2 hydrochloride

生物活性：

Description

PFI-2 hydrochloride is a a first-in-class, potent, highly selective, and cell-active inhibitor of the methyltransferase activity of SETD7 with IC50 of 2 nM, 500 fold active than (S)-PFI-2. IC50 value: 2 nM [1] Target: SETD7 (R)-PFI-2 is highly selective (>1,000-fold) for SETD7, over a panel of 18 other human protein methyltransferases and DNMT1, and was shown to be inactive against 134 additional ion channel, GPCR, and enzyme targets (<35% inhibition at 10 μM). (R)-PFI-2 binds to SETD7 only in the presence of SAM. PFI-766, a biotinylated variant of (R)-PFI-2 that retains the ability to bind and inhibit SETD7 (IC50 110 ± 26 nM in our in vitro enzymatic assay). PFI-766 engagement of endogenous SETD7 was also confirmed by mass spectrometry that supported the high specificity of the compound for endogenous SETD7.

Solvent&Solubility

In Vitro:

DMSO : ≥ 32 mg/mL (59.70 mM)

H_2O : 5.56 mg/mL (10.37 mM; Need ultrasonic)

* "≥" means soluble, but saturation unknown.

Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.8657 mL	9.3287 mL	18.6574 mL
	5 mM	0.3731 mL	1.8657 mL	3.7315 mL
	10 mM	0.1866 mL	0.9329 mL	1.8657 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 (4.66 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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 (4.66 mM); Clear solution

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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。

	3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.66 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (4.66 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]. Barsyte-Lovejoy D, et al. (R)-PFI-2 is a potent and selective inhibitor of SETD7 methyltransferase activity in cells. Proc Natl Acad Sci U S A. 2014 Sep 2;111(35):12853-8.