



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

产品名称: **ARV-825**  
产品别名: **ARV-825**

生物活性:				
Description	ARV-825 is a BRD4 degrader based on PROTAC technology. ARV-825 binds to BD1 and BD2 of BRD4 with $K_d$ s of 90 and 28 nM, respectively.			
IC <sub>50</sub> & Target	Kd: 90 nM (Bromodomain 1 of BRD4), 28 nM (Bromodomain 2 of BRD4) <sup>[1]</sup>			
In Vitro	ARV-825 is a hetero-bifunctional proteolysis-targeting chimera (PROTAC) that recruits BRD4 to the E3 ubiquitin ligase cereblon. ARV-825 actively recruits BRD4 to cereblon, resulting in the rapid and efficient degradation of the former via the proteasome. Given that BRD4 and cereblon binding moieties in ARV-825 have $K_d$ s of 28-90 nM and ~3 $\mu$ M to their respective targets, this suggests that ARV-825 acts in a substoichiometric way in mediating BRD4 degradation. ARV-825 treatment results in prolonged BRD4 down-regulation and downstream signaling suppression compared to BRD4 inhibitors <sup>[1]</sup> .			
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b> <b>DMSO : <math>\geq</math> 50 mg/mL (54.15 mM)</b>  * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown.			
	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg
		1 mM	1.0829 mL	5.4146 mL
		5 mM	0.2166 mL	1.0829 mL
		10 mM	0.1083 mL	0.5415 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。			
	<b>In Vivo:</b> 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: $\geq$ 2.5 mg/mL (2.71 mM); Clear solution 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (2.71 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 $\mu$ L PEG300 中, 混合均匀, 向上述体系中加入 50 $\mu$ L Tween-80, 混合均匀; 然后继续加入 450 $\mu$ L 生理盐水定容至 1 mL。  2.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (2.71 mM); Clear solution 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (2.71 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。			



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 $\mu$ L 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Lu J, et al. Hijacking the E3 Ubiquitin Ligase Cereblon to Efficiently Target BRD4. Chem Biol. 2015 Jun 18;22(6):755-63.
实验参考:	
Kinase Assay	Affinity of compounds (e.g., ARV-825) with Bromodomain 1 and 2 of BRD4 is determined with BROMOScan by DiscoverX[1].
References	[1]. Lu J, et al. Hijacking the E3 Ubiquitin Ligase Cereblon to Efficiently Target BRD4. Chem Biol. 2015 Jun 18;22(6):755-63.



源叶生物