



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
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **HDAC-IN-4**
产品别名: **CXD101**

生物活性:

Description	CXD101 is a potent, selective and orally active class I HDAC inhibitor with IC50s of 63 nM, 570 nM and 550 nM for HDAC1, HDAC2 and HDAC3, respectively. CXD101 has no activity against HDAC class II. CXD101 has antitumor activity[1][2].				
IC ₅₀ & Target	HDAC1	HDAC3	HDAC2		
	63 nM (IC ₅₀)	550 nM (IC ₅₀)	570 nM (IC ₅₀)		
In Vitro	CXD101 has been tested in vitro in colon, lung, non-Hodgkin lymphoma, and myeloma cell lines with IC50s ranged from 0.2 to 15 μM[2].				
In Vivo	CXD101 substantially reduces tumor size in murine xenograft lung (A549a) and colon (HT29) models at a dose of 50 mg/kg. Tumor reductions are found to be associated with increased histone acetylation and decreased HDAC enzyme activity[2].				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 31 mg/mL (76.82 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.				
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.4782 mL	12.3910 mL	24.7819 mL
		5 mM	0.4956 mL	2.4782 mL	4.9564 mL
		10 mM	0.2478 mL	1.2391 mL	2.4782 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 (6.20 mM); Clear solution					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.20 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 (6.20 mM); Clear solution					
此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.20 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。					



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
邮箱: shyysw@sina.com

	<p>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 生理盐水溶液中, 混合均匀。</p> <p>3. 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO \rightarrow 90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.20 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (6.20 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。</p> <p>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。</p>
References	<p>[1]. Eyre TA, et al. Predictive biomarkers for disease sensitivity in lymphoma - the holy grail for HDAC inhibitors? <i>Oncotarget</i>. 2018 Dec 18;9(99):37280-37281.</p> <p>[2]. Eyre TA, et al. A phase 1 study to assess the safety, tolerability, and pharmacokinetics of CXD101 in patients with advanced cancer. <i>Cancer</i>. 2019 Jan 1;125(1):99-108.</p>

源叶生物