

HB181203

BI6727

产品信息

产品名称	产品编号	规格
BI6727	51106ES08	5mg
BI6727	51106ES10	10mg

产品描述

BI6727 又称为 BI-6727、Volasertib, 是一种高度有效的、ATP 竞争性 PLK1 抑制剂, IC_{50} 为 0.87 nM, 比作用于 PLK2 和 PLK3 选择性高 6 和 65 倍, IC_{50} 分别为 5 nM 和 56 nM。BI6727 对多种癌细胞具有明显的抗肿瘤活性, 抑制多种细胞增殖, 包括 HCT 116 ($EC_{50} = 23$ nM)、NCI-H460 ($EC_{50}=21$ nM) 和 BRO ($EC_{50}=11$ nM) 等, 并抑制体内移植瘤生长。另外, BI6727 还可以抑制 bromodomain 和 BRD4 蛋白活性。

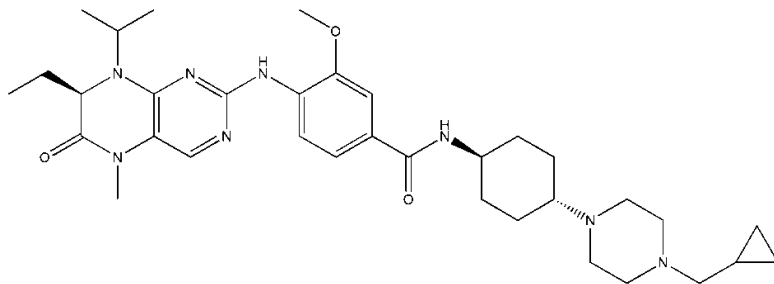
目前, BI6727 已用于临床 Phase 3 研究阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	BI-6727, Volasertib
化学名 (Chemical Name)	N-[trans-4-[4-(cyclopropylmethyl)-1-piperazinyl]cyclohexyl]-4-[[[(7R)-7-ethyl-5,6,7,8-tetrahydro-5-methyl-8-(1-methylethyl)-6-oxo-2-pteridiny]amino]-3-methoxy-benzamide
靶点 (Target)	PLK1
CAS 号 (CAS NO.)	755038-65-4
分子式 (Molecular Formula)	$C_{34}H_{50}N_8O_3$
分子量 (Molecular Weight)	618.8
外观 (Appearance)	结晶性粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 $-20\text{ }^{\circ}\text{C}$ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

为检测 BI 6727 在细胞中的作用，用 100 nM BI 6727 处理 NCI-H460 细胞 24 h，发现有丝分裂细胞聚集，细胞中有单极纺锤体和组蛋白 H3 的磷酸丝氨酸 10 阳性染色，表明细胞处于 M 期，随后诱导细胞凋亡。^[1]

（二）动物实验（体内研究）

在体内实验中，给 HCT116 移植瘤小鼠静脉注射 BI 6727（15、20、25 mg/kg），BI 6727 引起显著的肿瘤延迟，甚至肿瘤衰退。^[1]

参考文献

- [1] Rudolph D, et al. BI 6727, a Polo-like kinase inhibitor with improved pharmacokinetic profile and broad antitumor activity. *Clin Cancer Res.* 15(9): 3094-3102 (2009).
- [2] Grinshtein N, et al. Small molecule kinase inhibitor screen identifies polo-like kinase 1 as a target for neuroblastoma tumor-initiating cells. *Cancer Res.* 71(4): 1385-1395 (2011).
- [3] Gjertsen BT, et al. Discovery and development of the Polo-like kinase inhibitor volasertib in cancer therapy. *Leukemia* 29: 11–19 (2015).
- [4] Kumar S, et al. PLK-1 Targeted Inhibitors and Their Potential against Tumorigenesis. *Biomed Res Int.* (2015).