



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **Talazoparib tosylate**
CAS 号: **1373431-65-2**
产品货号: **S29706**

生物活性:				
Description	Talazoparib tosylate (BMN 673ts) 是一种新型, 高效, 有口服活性的 PARP1/2 抑制剂, 抑制 PARP1 的 IC50 值为 0.57 nM.			
IC50 & Target	IC50: 0.57 nM (PARP1)[1]			
In Vitro	Talazoparib 是一种有效的 PARP1/2 抑制剂 (PARP1 IC50=0.57 nM), 在浓度高达 1 μ M 时对 PARG 活性没有影响。Talazoparib 以 0.29 nM 的解离常数 (KD) 结合 PARP1。Talazoparib 抑制 PARP1 和 -2 的程度相似, Ki 分别为 1.20 和 0.85 nM。Talazoparib 选择性靶向具有 BRCA1、BRCA2 或 PTEN 基因缺陷的肿瘤细胞, 效力比现有的 PARP1/2 抑制剂高 20 至 200 多倍。Talazoparib 靶向具有同源重组基因缺陷的肿瘤细胞。BRCA1 缺陷 (MX-1 和 SUM149) 或 BRCA2 缺陷 (Capan-1) 的肿瘤模型对 Talazoparib 极为敏感。Talazoparib 在浓度低至 100 pM 时即可诱导核 γ -H2AX 焦点[1]。			
In Vivo	Talazoparib 很容易口服生物利用度, 当在羧甲基纤维素中给药时, 大鼠的绝对口服生物利用度超过 40%。Talazoparib 的口服给药具有显著的抗肿瘤活性; 由于 BRCA 突变或 PTEN 缺陷, 携带 DNA 修复缺陷的异种移植肿瘤对小鼠口服耐受良好剂量的 Talazoparib 处理非常敏感。当 Talazoparib 与替莫唑胺、SN38 或铂类药物联合使用时, 也发现了协同或相加的抗肿瘤作用[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 108 mg/mL (195.46 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H2O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown.			
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	1.8098 mL	9.0490 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.3620 mL	1.8098 mL
		10 mM	0.1810 mL	0.9049 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。 动物实验: 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 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (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: shyyssw@sina.com

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (4.52 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Shen Y, et al. BMN 673, a novel and highly potent PARP1/2 inhibitor for the treatment of human cancers with DNA repair deficiency. Clin Cancer Res. 2013 Sep 15;19(18):5003-15.

完整储备液配制表:

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 (sealed storage, away from moisture)。-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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.8098 mL	9.0490 mL	18.0979 mL	45.2448 mL
	5 mM	0.3620 mL	1.8098 mL	3.6196 mL	9.0490 mL
	10 mM	0.1810 mL	0.9049 mL	1.8098 mL	4.5245 mL
	15 mM	0.1207 mL	0.6033 mL	1.2065 mL	3.0163 mL
	20 mM	0.0905 mL	0.4524 mL	0.9049 mL	2.2622 mL
	25 mM	0.0724 mL	0.3620 mL	0.7239 mL	1.8098 mL
	30 mM	0.0603 mL	0.3016 mL	0.6033 mL	1.5082 mL
	40 mM	0.0452 mL	0.2262 mL	0.4524 mL	1.1311 mL
	50 mM	0.0362 mL	0.1810 mL	0.3620 mL	0.9049 mL
	60 mM	0.0302 mL	0.1508 mL	0.3016 mL	0.7541 mL
	80 mM	0.0226 mL	0.1131 mL	0.2262 mL	0.5656 mL
	100 mM	0.0181 mL	0.0905 mL	0.1810 mL	0.4524 mL