



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: **PARP/PI3K-IN-1**
CAS 号: **2337386-47-5**
产品货号: **S34302**

生物活性:

Description	PARP/PI3K-IN-1 (compound 15) 是一种有效的 PARP/PI3K 抑制剂, 对 PARP-1, PARP-2, PI3K α , PI3K β , PI3K δ 和 PI3K γ 的 pIC ₅₀ 值分别为 8.22、8.44、8.25、6.54、8.13、6.08。PARP/PI3K-IN-1 是针对多种肿瘤疾病的高效抗癌化合物。					
IC50 & Target[1]	PARP-1 8.22 (pIC ₅₀) PI3K δ 8.13 (pIC ₅₀)	PARP-2 8.44 (pIC ₅₀) PI3K γ 6.08 (pIC ₅₀)	PI3K α 8.25 (pIC ₅₀) PI3K β 6.54 (pIC ₅₀)			
In Vitro	PARP/PI3K-IN-1 (compound 15; 1 μ M; 72 hours) leads to a significant increase in cell apoptosis[1].					
	PARP/PI3K-IN-1 (1 μ M; 72 hours) reduces the autophosphorylation levels of AKT and S6 while increases the autophosphorylation level of ERK after treating cells, indicating that it can inhibit the PI3K pathway and activate the ERK pathway[1].					
	PARP/PI3K-IN-1 (1 μ M) displays a strong capability to downregulate the expression of BRCA1/2 at the mRNA level in MDA-MB-468 cancer cells[1].					
	PARP/PI3K-IN-1 not only shows significant inhibitory activity against BRCA-deficient cells HCC1937 and HCT116, but also displays potent anti-proliferative activity against BRCA-proficient cells MDA-MB-231 and MDA-MB-468[1].					
	Apoptosis Analysis[1]					
	Cell Line:	MDA-MB-468 cancer cells				
	Concentration:	1 μ M				
	Incubation Time:	72 hours				
Result:	Led to a significant increase in cell apoptosis.					
In Vivo	PARP/PI3K-IN-1 (i.p.; 50 mg/kg; twice daily (BID) for 34 consecutive days) significantly suppresses the tumor growth[1].					
	Animal Model:	Six-week-old male BALB/c nude mice with MDA-MB-468 cells[1]				
	Dosage:	50 mg/kg				
	Administration:	i.p.; twice daily (BID) for 34 consecutive days				
	Result:	Significantly suppressed the tumor growth.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (151.37 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM		1.5137 mL	7.5686 mL	15.1373 mL
		5 mM		0.3027 mL	1.5137 mL	3.0275 mL
		10 mM		0.1514 mL	0.7569 mL	1.5137 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。 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.78 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。 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; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (3.78 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.78 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, 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Wang J, et al.Discovery of Novel Dual Poly(ADP-ribose)polymerase and Phosphoinositide 3-Kinase Inhibitors as a Promising Strategy for Cancer Therapy.J Med Chem. 2020 Jan 9;63(1):122-139.

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。 -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
	1 mM	1.5137 mL	7.5686 mL	15.1373 mL	37.8432 mL



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

DMSO	5 mM	0.3027 mL	1.5137 mL	3.0275 mL	7.5686 mL
	10 mM	0.1514 mL	0.7569 mL	1.5137 mL	3.7843 mL
	15 mM	0.1009 mL	0.5046 mL	1.0092 mL	2.5229 mL
	20 mM	0.0757 mL	0.3784 mL	0.7569 mL	1.8922 mL
	25 mM	0.0605 mL	0.3027 mL	0.6055 mL	1.5137 mL
	30 mM	0.0505 mL	0.2523 mL	0.5046 mL	1.2614 mL
	40 mM	0.0378 mL	0.1892 mL	0.3784 mL	0.9461 mL
	50 mM	0.0303 mL	0.1514 mL	0.3027 mL	0.7569 mL
	60 mM	0.0252 mL	0.1261 mL	0.2523 mL	0.6307 mL
	80 mM	0.0189 mL	0.0946 mL	0.1892 mL	0.4730 mL
	100 mM	0.0151 mL	0.0757 mL	0.1514 mL	0.3784 mL



源叶