



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: shyyssw@sina.com

产品名称: **LOC14**  
CAS 号: **877963-94-5**  
产品货号: **S87853**

**生物活性:**

|                                                                                                                                   |                                                                                                                                               |                                                                  |           |            |            |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------|-----------|------------|------------|
| Description                                                                                                                       | LOC14 是蛋白质二硫键异构酶 (PDI) 抑制剂 (EC50=500 nM; Kd=62 nM)。LOC14 在小鼠肝微粒体和血浆中表现出高稳定性, 低内在微粒体清除率和低血浆蛋白结合。LOC14 抑制 PDIA3 活性, 降低肺上皮细胞中 HA 的分子内二硫键和随后的寡聚化。 |                                                                  |           |            |            |
| IC50 & Target                                                                                                                     | Kd: 62 nM (PDI)[1]                                                                                                                            |                                                                  |           |            |            |
| In Vitro                                                                                                                          | LOC14 (0.01-100 μM; 24 小时) 表现出抑制重组 (r) PDIA3 的能力, IC50 约为 5 μM[3]。Cell Viability Assay[3]                                                     |                                                                  |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Cell Line:                                                                                                                                    | MTEC cells                                                       |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Concentration:                                                                                                                                | 0.01 μM; 0.1 μM; 0.5 μM; 1 μM; 5 μM; 10 μM; 100 μM               |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Incubation Time:                                                                                                                              | 24 hours                                                         |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Result:                                                                                                                                       | Inhibited recombinant (r)PDIA3 activity.                         |           |            |            |
| In Vivo                                                                                                                           | LOC14 (灌胃口服给药; 20 mg/kg; 每日一次; 12-28 周) 显著改善 N171 - 82Q HD 小鼠的运动功能, 减轻脑萎缩并延长生存期[2]。                                                           |                                                                  |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Animal Model:                                                                                                                                 | Male N171-82Q HD mice[2]                                         |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Dosage:                                                                                                                                       | 20 mg/kg                                                         |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Administration:                                                                                                                               | Orally administered by gavage; 20 mg/kg; once daily; 12-28 weeks |           |            |            |
|                                                                                                                                   | Result:                                                                                                                                       | Improved motor function in HD mice.                              |           |            |            |
| Solvent&Solubility                                                                                                                | 细胞实验:                                                                                                                                         |                                                                  |           |            |            |
|                                                                                                                                   | DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (157.52 mM; 超声助溶 (<60°C); 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 / Mass Concentration                                     | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|                                                                                                                                   |                                                                                                                                               | 1 mM                                                             | 3.1505 mL | 15.7525 mL | 31.5050 mL |
|                                                                                                                                   |                                                                                                                                               | 5 mM                                                             | 0.6301 mL | 3.1505 mL  | 6.3010 mL  |
|                                                                                                                                   |                                                                                                                                               | 10 mM                                                            | 0.3150 mL | 1.5752 mL  | 3.1505 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; 该产品在溶液状态不稳定, 建议您现用现配, 即刻使用。                                                                                   |                                                                  |           |            |            |
|                                                                                                                                   | 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: ≥ 2.08 mg/mL (6.55 mM); 澄清溶液                                                                                          |                                                                                                                                               |                                                                  |           |            |            |
| 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。                                                                                                |                                                                                                                                               |                                                                  |           |            |            |
| 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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 |                                                                                                                                               |                                                                  |           |            |            |



|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |
|------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | <p>mL。</p> <p>生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH<sub>2</sub>O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。</p> <p>方案 二</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline)</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.55 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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。</p> <p>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。</p> <p>方案 三</p> <p>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.55 mM); 澄清溶液</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.08 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。</p> <p>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。</p> |
| 参考文献 | <p>[1]. Kaplan A, et al. Small molecule-induced oxidation of protein disulfide isomerase is neuroprotective. Proc Natl Acad Sci U S A. 2015 Apr 28;112(17):E2245-52.</p> <p>[2]. Chamberlain N, et al. Lung epithelial protein disulfide isomerase A3 (PDIA3) plays an important role in influenza infection, inflammation, and airway mechanics. Redox Biol. 2019 Apr;22:101129.</p> <p>[3]. Zhou X, et al. Small molecule modulator of protein disulfide isomerase attenuates mutant huntingtin toxicity and inhibits endoplasmic reticulum stress in a mouse model of Huntington's disease. Hum Mol Genet. 2018 May 1;27(9):1545-1555.</p>                                |

#### 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; 该产品在溶液状态不稳定, 建议您现用现配, 即刻使用。

| 可选溶剂 | 质量<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 3.1505 mL | 15.7525 mL | 31.5050 mL | 78.7625 mL |
|      | 5 mM             | 0.6301 mL | 3.1505 mL  | 6.3010 mL  | 15.7525 mL |
|      | 10 mM            | 0.3150 mL | 1.5752 mL  | 3.1505 mL  | 7.8762 mL  |
|      | 15 mM            | 0.2100 mL | 1.0502 mL  | 2.1003 mL  | 5.2508 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1575 mL | 0.7876 mL  | 1.5752 mL  | 3.9381 mL  |
|      | 25 mM            | 0.1260 mL | 0.6301 mL  | 1.2602 mL  | 3.1505 mL  |
|      | 30 mM            | 0.1050 mL | 0.5251 mL  | 1.0502 mL  | 2.6254 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0788 mL | 0.3938 mL  | 0.7876 mL  | 1.9691 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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyysw@sina.com

|  |        |           |           |           |           |
|--|--------|-----------|-----------|-----------|-----------|
|  | 50 mM  | 0.0630 mL | 0.3150 mL | 0.6301 mL | 1.5752 mL |
|  | 60 mM  | 0.0525 mL | 0.2625 mL | 0.5251 mL | 1.3127 mL |
|  | 80 mM  | 0.0394 mL | 0.1969 mL | 0.3938 mL | 0.9845 mL |
|  | 100 mM | 0.0315 mL | 0.1575 mL | 0.3150 mL | 0.7876 mL |



源叶