



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: shyyw@sina.com

产品名称: **AZ 9482**
CAS 号: **1825345-33-2**
产品货号: **S87880**

生物活性:

Description	AZ9482 是 PARP1/2/6 的三重抑制剂, 其对 PARP1/2/6 的 IC50 值分别为 1 nM、1 nM 和 640 nM。			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	HeLa	EC ₅₀	< 0.018 μ M	Inhibition of PARP in human HeLa cells assessed as induction of centrosome declustering after 48 hrs by DAPI-staining based image analysis
	MCF7	EC ₅₀	123 nM	Inhibition of PARP in multi-drug resistant human MCF7 cells assessed as induction of centrosome declustering after 48 hrs by DAPI-staining based image analysis
	MDA-MB-468	EC ₅₀	3 nM	Inhibition of PARP in human MDA-MB-468 cells assessed as induction of centrosome declustering after 48 hrs by DAPI-staining based image analysis
	OCI-LY19	IC ₅₀	0.003 μ M	Cytotoxicity against human OCI-LY19 assessed as growth inhibition after 3 days by Alamar Blue assay
	Sf9	IC ₅₀	0.001 μ M	Inhibition of full length human PARP1 expressed in Baculovirus infected Sf9 insect cells using activated DNA as substrate after 1 hr by streptavidin-horseradish peroxidase-based luminescence assay
	Sf9	IC ₅₀	0.001 μ M	Inhibition of human PARP2 (2 to 583 residues) expressed in Baculovirus infected Sf9 insect cells using activated DNA as substrate after 1 hr by streptavidin-horseradish peroxidase-based luminescence assay
	Sf9	IC ₅₀	0.009 μ M	Inhibition of human TNKS1 (1001 to 1327 residues) expressed in Baculovirus infected Sf9 insect cells using activated DNA as substrate after 1 hr by streptavidin-horseradish peroxidase-based luminescence assay
	Sf9	IC ₅₀	0.16 μ M	Inhibition of human TNKS2 (667 to 1166 residues) expressed in Baculovirus infected Sf9 insect cells using activated DNA as substrate after 1 hr by streptavidin-horseradish peroxidase-based luminescence assay
In Vitro	Sf9	IC ₅₀	0.64 μ M	Inhibition of full length human PARP6 expressed in a Baculovirus infected Sf9 insect cells using activated DNA as substrate after 1 hr by streptavidin-horseradish peroxidase-based luminescence assay
	AZ9482 在 MDA-MB-468 细胞[1] 中的 EC50 为 24 nM[1]。 AZ0108 可抑制 CHK1 甲基化并诱导 CHK1 磷酸化, 有助于 MPS 形成[1]。			



	Cell Viability Assay[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>MDA-MB-468 cells.</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>0-10 μM.</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>3 days.</td></tr><tr><td>Result:</td><td>EC₅₀ was 24 nM.</td></tr></table>	Cell Line:	MDA-MB-468 cells.	Concentration:	0-10 μ M.	Incubation Time:	3 days.	Result:	EC ₅₀ was 24 nM.									
Cell Line:	MDA-MB-468 cells.																	
Concentration:	0-10 μ M.																	
Incubation Time:	3 days.																	
Result:	EC ₅₀ was 24 nM.																	
In Vivo	AZ0108 also displays toxicity in vivo, the molecular basis of which is currently undefined, limiting pharmacological evaluation of AZ0108[1]。																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (277.48 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) <table><tr><th rowspan="4">Preparing Stock Solutions</th><th> Solvent / Mass / Concentration </th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><td>1 mM</td><td>2.2198 mL</td><td>11.0990 mL</td><td>22.1981 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.4440 mL</td><td>2.2198 mL</td><td>4.4396 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.2220 mL</td><td>1.1099 mL</td><td>2.2198 mL</td></tr></table> *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: 2.08 mg/mL (4.62 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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 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: 2.08 mg/mL (4.62 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 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 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。 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	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	2.2198 mL	11.0990 mL	22.1981 mL	5 mM	0.4440 mL	2.2198 mL	4.4396 mL	10 mM	0.2220 mL	1.1099 mL	2.2198 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		2.2198 mL	11.0990 mL	22.1981 mL													
	5 mM		0.4440 mL	2.2198 mL	4.4396 mL													
	10 mM	0.2220 mL	1.1099 mL	2.2198 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

	请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.62 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, 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 20.8 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]. Ryan T Howard, et al. Structure-Guided Design and In-Cell Target Profiling of a Cell-Active Target Engagement Probe for PARP Inhibitors. ACS Chem Biol. 2020 Feb 21;15(2):325-333.

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
DMSO	1 mM	2.2198 mL	11.0990 mL	22.1981 mL	55.4951 mL
	5 mM	0.4440 mL	2.2198 mL	4.4396 mL	11.0990 mL
	10 mM	0.2220 mL	1.1099 mL	2.2198 mL	5.5495 mL
	15 mM	0.1480 mL	0.7399 mL	1.4799 mL	3.6997 mL
	20 mM	0.1110 mL	0.5550 mL	1.1099 mL	2.7748 mL
	25 mM	0.0888 mL	0.4440 mL	0.8879 mL	2.2198 mL
	30 mM	0.0740 mL	0.3700 mL	0.7399 mL	1.8498 mL
	40 mM	0.0555 mL	0.2775 mL	0.5550 mL	1.3874 mL
	50 mM	0.0444 mL	0.2220 mL	0.4440 mL	1.1099 mL
	60 mM	0.0370 mL	0.1850 mL	0.3700 mL	0.9249 mL
	80 mM	0.0277 mL	0.1387 mL	0.2775 mL	0.6937 mL
	100 mM	0.0222 mL	0.1110 mL	0.2220 mL	0.5550 mL