



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: **GeA-69**
CAS 号: **2143475-98-1**
产品货号: **S88582**

生物活性:

Description	GeA-69 是一种选择性的 PARP14 变构抑制剂, 靶向作用于 macrodomain 2 (MD2), Kd 值为 2.1 μM。GeA-69 参与 DNA 损伤修复机制, 能够防止 PARP14 MD2 募集到激光诱导的 DNA 损伤部位。				
IC50 & Target[1]	PARP14 2.1 μM (Kd)				
In Vitro	GeA-69 (Compound 1) (50 μM 和 250 μM; 预损伤 1 小时或 0.5、1、2.5 分钟) 在完整细胞中结合 PARP14 MD2 并防止其定位到 U-2 OS 细胞中的 DNA 损伤位点[2]。				
	GeA-69 (25 nM-250 μM; 72 h) 在 HeLa、U-2 OS 和 HEK293 细胞中表现出中等的细胞毒性, 并且具有高细胞渗透性, 2% 通过细胞旁和 98% 跨膜细胞[2]。				
	Cell Cytotoxicity Assay[2]				
	Cell Line:	HeLa, U-2 OS and HEK293 cells			
	Concentration:	25 nM-250 μM			
Incubation Time:	72 hours				
	Result:	Resulted moderate cytotoxicity against normal cells with EC ₅₀ _HeLa=58 μM, EC ₅₀ _U-2 OS=52 μM, EC ₅₀ _HEK293=54 μM.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (416.18 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)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.3294 mL	16.6472 mL	33.2945 mL
		5 mM	0.6659 mL	3.3294 mL	6.6589 mL
		10 mM	0.3329 mL	1.6647 mL	3.3294 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline					
Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (6.93 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 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: $\geq$ 2.08 mg/mL (6.93 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Schuller M, et al. Discovery of a Selective Allosteric Inhibitor Targeting Macrodomain 2 of Polyadenosine-Diphosphate-Ribose Polymerase 14. ACS Chem Biol. 2017 Nov 17;12(11):2866-2874. [2]. Moustakim M, et al. Discovery of a novel allosteric inhibitor scaffold for polyadenosine-diphosphate-ribose polymerase 14 (PARP14) macrodomain 2. Bioorg Med Chem. 2018 Jul 15;26(11):2965-2972.

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	3.3294 mL	16.6472 mL	33.2945 mL	83.2362 mL
	5 mM	0.6659 mL	3.3294 mL	6.6589 mL	16.6472 mL
	10 mM	0.3329 mL	1.6647 mL	3.3294 mL	8.3236 mL
	15 mM	0.2220 mL	1.1098 mL	2.2196 mL	5.5491 mL
	20 mM	0.1665 mL	0.8324 mL	1.6647 mL	4.1618 mL
	25 mM	0.1332 mL	0.6659 mL	1.3318 mL	3.3294 mL
	30 mM	0.1110 mL	0.5549 mL	1.1098 mL	2.7745 mL
	40 mM	0.0832 mL	0.4162 mL	0.8324 mL	2.0809 mL
	50 mM	0.0666 mL	0.3329 mL	0.6659 mL	1.6647 mL
	60 mM	0.0555 mL	0.2775 mL	0.5549 mL	1.3873 mL
	80 mM	0.0416 mL	0.2081 mL	0.4162 mL	1.0405 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: shyysw@sina.com

	100 mM	0.0333 mL	0.1665 mL	0.3329 mL	0.8324 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶