



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: **Bobcat339**
CAS 号: **2280037-51-4**
产品货号: **S88618**

生物活性:				
Description	Bobcat339 是一种有效的、选择性的基于胞嘧啶的 TET 酶抑制剂,抑制 TET1 和 TET2 的 IC50 值分别为 33 μ M 和 73 μ M。Bobcat339 可用于表观遗传学领域研究,并且可作为靶向 DNA 甲基化和基因转录新疗法的起点。			
IC50 & Target[1]	TET1 33 μ M (IC50)	TET2 73 μ M (IC50)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Sf9	IC ₅₀	33 μ M	Inhibition of recombinant human N-terminal FLAG-tagged TET1 (1418 to 2136 residues) expressed in baculovirus infected sf9 cells assessed as reduction in oxidation of methylated dsDNA after 2 hrs by chemiluminescence assay
Cellular Effect	Sf9	IC ₅₀	73 μ M	Inhibition of recombinant human C-terminal His/N-terminal FLAG-tagged TET2 (1129 to 2002 residues) expressed in baculovirus infected sf9 cells assessed as reduction in oxidation of methylated dsDNA after 2 hrs by chemiluminescence assay
In Vitro	Bobcat339 (10 μ M; 24 小时)通过抑制 HT-22 细胞中的 TET 酶功能显著降低整体 5hmC 水平[1]。 Nicholas A Weirath 等人发现 Bobcat339 的抑制活性与 Cu(II) 含量直接相关。Bobcat339-铜混合物对 TET 的抑制活性远高于单独的 Bobcat339 或 Cu(II)[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (335.86 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 Mass Concentration	1 mg	5 mg
Solvent&Solubility	1 mM	3.3586 mL	16.7932 mL	33.5864 mL
	5 mM	0.6717 mL	3.3586 mL	6.7173 mL
Solvent&Solubility	10 mM	0.3359 mL	1.6793 mL	3.3586 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 (8.40 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (8.40 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: 2.5 mg/mL (8.40 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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。 以下溶解方案, 请直接配制工作液。建议现用现配, 在短期内尽快用完。 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: 0.5% CMC-Na/saline water Solubility: 3.33 mg/mL (11.18 mM); 悬浊液; 超声助溶 (<60°C)。
参考文献	[1]. Chua GNL, et, al. Cytosine-Based TET Enzyme Inhibitors. ACS Med Chem Lett. 2019 Jan 31; 10(2): 180-185. [2]. Weirath NA, et al. Small Molecule Inhibitors of TET Dioxygenases: Bobcat339 Activity Is Mediated by Contaminating Copper(II). ACS Med Chem Lett. 2022 Apr 21;13(5):792-798.

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	3.3586 mL	16.7932 mL	33.5864 mL	83.9659 mL
	5 mM	0.6717 mL	3.3586 mL	6.7173 mL	16.7932 mL
	10 mM	0.3359 mL	1.6793 mL	3.3586 mL	8.3966 mL
	15 mM	0.2239 mL	1.1195 mL	2.2391 mL	5.5977 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

	20 mM	0.1679 mL	0.8397 mL	1.6793 mL	4.1983 mL
	25 mM	0.1343 mL	0.6717 mL	1.3435 mL	3.3586 mL
	30 mM	0.1120 mL	0.5598 mL	1.1195 mL	2.7989 mL
	40 mM	0.0840 mL	0.4198 mL	0.8397 mL	2.0991 mL
	50 mM	0.0672 mL	0.3359 mL	0.6717 mL	1.6793 mL
	60 mM	0.0560 mL	0.2799 mL	0.5598 mL	1.3994 mL
	80 mM	0.0420 mL	0.2099 mL	0.4198 mL	1.0496 mL
	100 mM	0.0336 mL	0.1679 mL	0.3359 mL	0.8397 mL



源叶