



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: **AZD5305; Saruparib**
CAS 号: **2589531-76-8**
产品货号: **S89283**

生物活性:

Description	Saruparib (AZD5305) 是一种口服有效的, 具有选择性的多聚 ADP 核糖聚合酶抑制剂和捕集剂, 对 PARP1 和 PARP2 的 IC50 值分别为 3 nM 和 1400 nM。Saruparib 具有抗增殖活性, 并抑制 DNA 修复缺陷细胞的生长。				
IC50 & Target[1]	PARP1 3 nM (IC50)		PARP2 1400 nM (IC50)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	DLD-1	IC50	0.002 μM	Antiproliferative activity against human DLD-1 deficient in BRCA-2 cells measured after 7 days	
	DLD-1	IC50	0.915 nM	Antiproliferative activity against human DLD-1 cells harbouring BRCA-2 mutant assessed as inhibition of cell growth	
	DLD-1	IC50	12.06 μM	Antiproliferative activity against human DLD-1 cells harbouring wild type BRCA assessed as inhibition of cell growth	
In Vitro	Saruparib (AZD5305) (0.1 nM-100 μM) 通过选择性阻断 PARP1 酶活性来抑制 A549 WT 细胞的 PARylation, IC50 值为 2.3 nM[1]。				
	AZD5305 (0.1 nM-100 μM) 是 PARP1 的有效选择性捕集剂, 以个位数纳摩尔浓度剂量依赖性捕集 PARP1[1]。				
	AZD5305 (0.1 nM-100 μM; 48 h; DLD1 WT and DLD1 BRCA2-/-) 针对 HRR 缺陷的癌细胞具有抗增殖活性, 诱导 DNA 损伤积累和细胞周期阻滞[1]。				
In Vivo	Saruparib (AZD5305) (0.01-0.3 mg/kg; p.o.; 每天, 持续 35 天; 雌性 Han Wistar 大鼠) 在体内 BRCAm 异种移植物和 PDX 模型中显示持续的抗肿瘤活性[1]。				
	Animal Model:		Female Han Wistar rats with BRCAm xenograft and PDX models (12-13 weeks of age)[1]		
	Dosage:		0.01, 0.03, 0.1, and 0.3 mg/kg		
	Administration:		Oral administration; daily, for 35 days		
	Result:		Had antitumor efficacy in a dose-dependent manner.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (61.50 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	2.4601 mL	12.3007 mL	24.6015 mL
		5 mM	0.4920 mL	2.4601 mL	4.9203 mL
		10 mM	0.2460 mL	1.2301 mL	2.4601 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。					



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

	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: ≥ 1 mg/mL (2.46 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 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: ≥ 1 mg/mL (2.46 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 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: ≥ 1 mg/mL (2.46 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 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 10.0 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]. Illuzzi G, et, al. Preclinical Characterization of AZD5305, A Next-Generation, Highly Selective PARP1 Inhibitor and Trapper. Clin Cancer Res. 2022 Nov 1;28(21):4724-4736. [2]. Johannes JW, et, al. Discovery of 5-{4-[(7-Ethyl-6-oxo-5,6-dihydro-1,5-naphthyridin-3-yl)methyl]piperazin-1-yl}-N-methylpyridine-2-carboxamide (AZD5305): A PARP1-DNA Trapper with High Selectivity for PARP1 over PARP2 and Other PARPs. J Med Chem. 2021 Oct 14;64(19):14498-14512.

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	2.4601 mL	12.3007 mL	24.6015 mL	61.5036 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

	5 mM	0.4920 mL	2.4601 mL	4.9203 mL	12.3007 mL
	10 mM	0.2460 mL	1.2301 mL	2.4601 mL	6.1504 mL
	15 mM	0.1640 mL	0.8200 mL	1.6401 mL	4.1002 mL
	20 mM	0.1230 mL	0.6150 mL	1.2301 mL	3.0752 mL
	25 mM	0.0984 mL	0.4920 mL	0.9841 mL	2.4601 mL
	30 mM	0.0820 mL	0.4100 mL	0.8200 mL	2.0501 mL
	40 mM	0.0615 mL	0.3075 mL	0.6150 mL	1.5376 mL
	50 mM	0.0492 mL	0.2460 mL	0.4920 mL	1.2301 mL
	60 mM	0.0410 mL	0.2050 mL	0.4100 mL	1.0251 mL



源叶