



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: DIPA
CAS 号: 302941-52-2
产品货号: S89322

生物活性:

Description	DUPA 是一种谷氨酸脲, 在活性分子偶联中作为靶向部分, 可选择靶向性地将细胞毒性药物递送到前列腺癌细胞。				
In Vitro	DUPA is used as the targeting moiety to actively deliver Docetaxel (DTX) for treatment of prostate-specific membrane antigen (PSMA) expressing prostate cancer[1]. The DUPA-indenoisoquinoline conjugate exhibits an IC50 in the low nanomolar range in 22RV1 cell cultures[2].				
In Vivo	The DUPA-indenoisoquinoline conjugate induces a complete cessation of tumor growth with no toxicity, as determined by loss of body weight and death of treated mice[2].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 300 mg/mL (936.77 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) H2O 中的溶解度 : ≥ 150 mg/mL (468.38 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	SolventMassConcentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.1226 mL	15.6128 mL	31.2256 mL
		5 mM	0.6245 mL	3.1226 mL	6.2451 mL
		10 mM	0.3123 mL	1.5613 mL	3.1226 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。 * 备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μm 的滤膜过滤除菌后使用。				
	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: ≥ 7.5 mg/mL (23.42 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 7.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 75.0 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 ddH ₂ O 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)				



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

	Solubility: ≥ 7.5 mg/mL (23.42 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 7.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 75.0 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: ≥ 7.5 mg/mL (23.42 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 7.5 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 75.0 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]. Peng ZH, et al. Spacer length impacts the efficacy of targeted docetaxel conjugates in prostate-specific membrane antigen expressing prostate cancer. J Drug Target. 2013 Dec;21(10):968-80. [2]. Roy J, et al. DUPA conjugation of a cytotoxic indenoisoquinoline topoisomerase I inhibitor for selective prostate cancer cell targeting. J Med Chem. 2015 Apr 9;58(7):3094-103.

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 $^{\circ}$ C, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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/H ₂ O	1 mM	3.1226 mL	15.6128 mL	31.2256 mL	78.0640 mL
	5 mM	0.6245 mL	3.1226 mL	6.2451 mL	15.6128 mL
	10 mM	0.3123 mL	1.5613 mL	3.1226 mL	7.8064 mL
	15 mM	0.2082 mL	1.0409 mL	2.0817 mL	5.2043 mL
	20 mM	0.1561 mL	0.7806 mL	1.5613 mL	3.9032 mL
	25 mM	0.1249 mL	0.6245 mL	1.2490 mL	3.1226 mL
	30 mM	0.1041 mL	0.5204 mL	1.0409 mL	2.6021 mL
	40 mM	0.0781 mL	0.3903 mL	0.7806 mL	1.9516 mL
	50 mM	0.0625 mL	0.3123 mL	0.6245 mL	1.5613 mL
	60 mM	0.0520 mL	0.2602 mL	0.5204 mL	1.3011 mL
	80 mM	0.0390 mL	0.1952 mL	0.3903 mL	0.9758 mL
	100 mM	0.0312 mL	0.1561 mL	0.3123 mL	0.7806 mL

备注: 如您选择水作为储备液, 请稀释至工作液后, 再用 0.22 μ m 的滤膜过滤除菌后使用。