



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: RU.521
CAS 号: 2262452-06-0
产品货号: S89346

生物活性:					
Description	RU.521 (RU320521) 是一种有效的, 选择性的环状 GMP-AMP 合成酶 (cGAS) 抑制剂, 抑制 cGAS 介导的干扰素上调。RU.521 也抑制 dsDNA 报告基因的活性, IC50 为 0.7 μM。RU.521 可以降低来自 Aicardi-Goutières 综合征小鼠模型的巨噬细胞中干扰素的组成型表达。				
IC50 & Target	IC50: 0.7 μM (dsDNA)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	H69AR	IC50	32.9 μM	Inhibition of human cGAS expressed in THP1-Dual cells transfected with HT-DNA assessed as suppression of lipofectamine 2000:ds-DNA complex induced activation of cGAS incubated for 1 hr by Quanti-luc reagent based assay	
	THP1-Dual	CC50	38.4 μM	Cytotoxicity against human THP1-Dual cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CCK-8 assay	
In Vitro	RU.521 (0.1 nM-1000 μM; 72 h) 抑制巨噬细胞中 dsDNA 诱导的信号传导[1]。 RU.521 (0-100 μM; 24 h) 选择性抑制 cGAS 介导的信号传导[1]。				
In Vivo	RU.521 (5 mg/kg; 腹腔注射一次) 减轻小鼠败血症的症状[2].				
	Animal Model:	Male 8-week-old male mice with LPS injection[2]			
	Dosage:	5 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; 5 mg/kg once			
	Result:	Increased cardiac function and reduced the inflammatory responses, oxidative stress and apoptosis in hearts of mice.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 83.33 mg/mL (200.68 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	10 mg
		1 mM	2.4083 mL	12.0415 mL	24.0830 mL
		5 mM	0.4817 mL	2.4083 mL	4.8166 mL
		10 mM	0.2408 mL	1.2042 mL	2.4083 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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。				
	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 (5.01 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.01 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。 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: 50% PEG300 → 50% Saline Solubility: 2 mg/mL (4.82 mM); 澄清溶液; 超声助溶
参考文献	[1]. Vincent J, et al. Small molecule inhibition of cGAS reduces interferon expression in primary macrophages from autoimmune mice. Nat Commun. 2017 Sep 29;8(1):750. [2]. Xu Q, et al. Small molecule inhibition of cyclic GMP-AMP synthase ameliorates sepsis-induced cardiac dysfunction in mice. Life Sci. 2020 Nov 1;260:118315.

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, 2 years; -20° C, 1 year. -80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4083 mL	12.0415 mL	24.0830 mL	60.2076 mL
	5 mM	0.4817 mL	2.4083 mL	4.8166 mL	12.0415 mL
	10 mM	0.2408 mL	1.2042 mL	2.4083 mL	6.0208 mL
	15 mM	0.1606 mL	0.8028 mL	1.6055 mL	4.0138 mL
	20 mM	0.1204 mL	0.6021 mL	1.2042 mL	3.0104 mL
	25 mM	0.0963 mL	0.4817 mL	0.9633 mL	2.4083 mL
	30 mM	0.0803 mL	0.4014 mL	0.8028 mL	2.0069 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

	40 mM	0.0602 mL	0.3010 mL	0.6021 mL	1.5052 mL
	50 mM	0.0482 mL	0.2408 mL	0.4817 mL	1.2042 mL
	60 mM	0.0401 mL	0.2007 mL	0.4014 mL	1.0035 mL
	80 mM	0.0301 mL	0.1505 mL	0.3010 mL	0.7526 mL
	100 mM	0.0241 mL	0.1204 mL	0.2408 mL	0.6021 mL



源叶