



生物活性:

Description	RBN012759 是一种有效的，选择性和具有口服活性的 PARP14 抑制剂，IC50 值 <3 nM，比 monoPARPs 的选择性高 300 倍，比 polyPARPs 的选择性高 1000 倍。RBN012759 可以降低肿瘤前巨噬细胞的功能并引起肿瘤外植体的炎症反应。																									
IC50 & Target	PARP14 <3 nM (IC50)	PARP4 10 μM (IC50)	PARP5a 8 μM (IC50)	PARP5b 10 μM (IC50)	PARP6 4 μM (IC50)	PARP7 4 μM (IC50)																				
	PARP8 20 μM (IC50)	PARP10 1 μM (IC50)	PARP11 1 μM (IC50)	PARP12 5 μM (IC50)	PARP15 3 μM (IC50)	PARP16 6 μM (IC50)																				
In Vitro	RBN012759 (0.01-10 μM) 在人原代巨噬细胞中降低与 PARP14 自身 MARYlation 对应的 MAR/PAR 信号，并以剂量依赖的方式稳定 PARP14 蛋白[1]。 RBN012759 (0.1-10 μM) 减少人原代巨噬细胞中 IL-4 刺激的细胞因子分泌[1]。																									
In Vivo	RBN012759 (500 mg/kg BID；口服) 在小鼠中具有良好的耐受性，重复给药[1]。 RBN012759 (100 mg/kg；口服) 表现出适度的口服生物利用度 (30%) 和由于中等清除率 (54 mL/min/kg) 和低稳态分布容积 (1.4 L/kg) 在小鼠体内的短血浆半衰期 (0.4 小时)[1]。																									
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度：233.33 mg/mL (616.52 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) <table border="1"><thead><tr><th rowspan="2"></th><th>Solvent / Mass Concentration</th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr></thead><tbody><tr><th>Preparing Stock Solutions</th><td>1 mM</td><td>2.6423 mL</td><td>13.2114 mL</td><td>26.4229 mL</td></tr><tr><td></td><td>5 mM</td><td>0.5285 mL</td><td>2.6423 mL</td><td>5.2846 mL</td></tr><tr><td></td><td>10 mM</td><td>0.2642 mL</td><td>1.3211 mL</td><td>2.6423 mL</td></tr></tbody></table> *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 (protect from light)。-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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.50 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 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。							Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	Preparing Stock Solutions	1 mM	2.6423 mL	13.2114 mL	26.4229 mL		5 mM	0.5285 mL	2.6423 mL	5.2846 mL		10 mM	0.2642 mL	1.3211 mL	2.6423 mL
	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																						
	Preparing Stock Solutions	1 mM	2.6423 mL	13.2114 mL	26.4229 mL																					
	5 mM	0.5285 mL	2.6423 mL	5.2846 mL																						
	10 mM	0.2642 mL	1.3211 mL	2.6423 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

	方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.50 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
参考文献	[1]. Schenkel L, et, al. A potent and selective PARP14 inhibitor decreases pro-tumor macrophage function and elicits inflammatory responses in tumor explants. AACR Annual Meeting 2020.

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 (protect from light)。 -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	2.6423 mL	13.2114 mL	26.4229 mL	66.0572 mL
	5 mM	0.5285 mL	2.6423 mL	5.2846 mL	13.2114 mL
	10 mM	0.2642 mL	1.3211 mL	2.6423 mL	6.6057 mL
	15 mM	0.1762 mL	0.8808 mL	1.7615 mL	4.4038 mL
	20 mM	0.1321 mL	0.6606 mL	1.3211 mL	3.3029 mL
	25 mM	0.1057 mL	0.5285 mL	1.0569 mL	2.6423 mL
	30 mM	0.0881 mL	0.4404 mL	0.8808 mL	2.2019 mL
	40 mM	0.0661 mL	0.3303 mL	0.6606 mL	1.6514 mL
	50 mM	0.0528 mL	0.2642 mL	0.5285 mL	1.3211 mL
	60 mM	0.0440 mL	0.2202 mL	0.4404 mL	1.1010 mL
	80 mM	0.0330 mL	0.1651 mL	0.3303 mL	0.8257 mL
	100 mM	0.0264 mL	0.1321 mL	0.2642 mL	0.6606 mL