



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

产品名称: **RBN-2397**
CAS 号: **2381037-82-5**
产品货号: **S89684**

生物活性:					
Description	RBN-2397 is a potent, accross species and orally active NAD+ competitive inhibitor of PARP7 (IC50<3 nM). RBN-2397 selectively binds to PARP7 (Kd=0.001 μM) and restores IFN signaling. RBN-2397 has the potential for the study of advanced or metastatic solid tumors[1][2].				
IC50 & Target[1]	PARP-7 3 nM (IC50)	PARP-7 1 nM (Kd)			
In Vitro	RBN-2397（0.0001-100 μM； 24 小时）抑制细胞增殖，在 NCI-H1373 肺癌细胞中的 IC50 值为 20 nM[2]。				
	RBN-2397（0.4 nM-1 μM； 24 小时）在 NCI-H1373 人肺癌细胞中以剂量依赖性方式增加 STAT1 磷酸化，从而恢复 I 型 IFN 应答[2]。				
	RBN-2397（0.0001-1 μM； 24 小时）在细胞生化测定中抑制细胞 MARylation，EC50 值为 1 nM[2]。				
	Cell Proliferation Assay[2]				
	Cell Line:	NCI-H1373 lung cancer cells			
	Concentration:	0.0001 μM; 0.001 μM; 0.001 μM; 0.1 μM; 1 μM; 10 μM; 100 μM			
	Incubation Time:	24 hours			
	Result:	Blocked cell proliferation.			
	Western Blot Analysis[2]				
	Cell Line:	NCI-H1373 lung cancer cells			
Concentration:	0.4 nM-1 μM				
Incubation Time:	24 hours				
Result:	Increased p-STAT1 protein expression.				
In Vivo	RBN-2397（口服； 3-100 mg/kg； 每日一次； 24-32 天）在 CT26 同源模型中诱导肿瘤特异性适应性免疫记忆，并在 CT26 肿瘤的 BALB/c 小鼠中产生持久的完全应答[2]。				
	RBN-2397（口服； 3-100 mg/kg； 每日一次； 32 天）在 100 mg/kg 剂量下引起完全消退，并在 ≥30 mg/kg 剂量水平下对肿瘤生长产生剂量依赖性影响[2]。				
	RBN-2397 在体内的半衰期 (t1/2) 为 325 分钟[2]。				
	Animal Model:	CB17 SCID mice with NCI-H1373 xenografts[2]			
	Dosage:	3 mg/kg, 10mg/kg, 30 mg/kg, 100 mg/kg			
	Administration:	Oral administration; once daily; 24-32 days			
Result:	Decreased tumor volume and exerted anti-tumor effects.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度：200 mg/mL (382.10 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	1.9105 mL	9.5524 mL	19.1048 mL
		5 mM	0.3821 mL	1.9105 mL	3.8210 mL
10 mM		0.1910 mL	0.9552 mL	1.9105 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℃, 1 year; -20℃, 6 months。-80℃ 储存时，请在 1 年内使用， -20℃ 储存时，请在 6 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： 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.78 mM); 澄清溶液 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 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 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.97 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。 方案 五 请依序添加每种溶剂： 1% DMSO → 99% Saline Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.96 mM); 澄清溶液
参考文献	[1]. RBN-2397-Inhibiting PARP7, a Key monoPARP Cancer Dependency [2]. Melissa Vasbinder, et al. RBN-2397: A First-in-Class PARP7 Inhibitor Targeting a Newly Discovered Cancer Vulnerability in Stress-Signaling Pathways.



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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 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	1.9105 mL	9.5524 mL	19.1048 mL	47.7619 mL
	5 mM	0.3821 mL	1.9105 mL	3.8210 mL	9.5524 mL
	10 mM	0.1910 mL	0.9552 mL	1.9105 mL	4.7762 mL
	15 mM	0.1274 mL	0.6368 mL	1.2737 mL	3.1841 mL
	20 mM	0.0955 mL	0.4776 mL	0.9552 mL	2.3881 mL
	25 mM	0.0764 mL	0.3821 mL	0.7642 mL	1.9105 mL
	30 mM	0.0637 mL	0.3184 mL	0.6368 mL	1.5921 mL
	40 mM	0.0478 mL	0.2388 mL	0.4776 mL	1.1940 mL
	50 mM	0.0382 mL	0.1910 mL	0.3821 mL	0.9552 mL
	60 mM	0.0318 mL	0.1592 mL	0.3184 mL	0.7960 mL
	80 mM	0.0239 mL	0.1194 mL	0.2388 mL	0.5970 mL
	100 mM	0.0191 mL	0.0955 mL	0.1910 mL	0.4776 mL