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：GSK2643943A
CAS 号：2449301-27-1
产品货号：S89956

生物活性：

Description	GSK2643943A is a deubiquitinating enzyme (DUB) inhibitor targeting USP20. GSK2643943A has affinity with an IC50 of 160 nM for USP20/Ub-Rho. GSK2643943A has anti-tumor efficacy and can be used for the research of oral squamous cell carcinoma (OSCC) [1][2].
IC50 & Target	IC50: 160 nM (USP20/Ub-Rho)[1]
In Vitro	GSK2643943A 阻断 USP20 介导的蛋白质-泛素键裂解[2]。 GSK2643943A (1 μM、5 μM；过夜) 使 SCC9 细胞对 oHSV-1 诱导的溶瘤作用更敏感[2]。 GSK2643943A (1 μM) 在感染 0.01 MOI T1012G 的 SCC9 中导致病毒产量显著增加[2]。

Cell Viability Assay[2]

Cell Line:	SCC9 cells
Concentration:	1 μM, 5 μM (GSK+0.01 MOI T1012) 1 μM (GSK+0.01 MOI/ 1 MOI T1012)
Incubation Time:	overnight
Result:	Displayed a significant drop in viability (R50%) (5 μM GSK+0.01 MOI T1012 infection) and 50% loss of SCC9 viability (1 μM GSK+0.01 MOI T1012 infection) . Remarkably reduced the viability of SCC9 upon exposure to 1 MOI T1012G infection.

Western Blot Analysis[2]

Cell Line:	SCC9 cells
Concentration:	1 μM
Incubation Time:	3h, 9 h and 20 h
Result:	Generally up-regulated the expression of viral proteins at various phases.

RT-PCR[2]

Cell Line:	SCC9 cells
Concentration:	1 μM
Incubation Time:	9 h
Result:	Significantly increased the accumulation of viral ICP8 and VP16 Mrna in SCC9 cells.

In Vivo

GSK2643943A (5 mg/kg，ip，每天，持续 6 天) 在 SCC9 肿瘤中增强 oHSV-1 诱导的溶瘤作用[2]。
GSK2643943A (2.5 mg/kg，ip，每天，持续 9 天) 在 SCC7 细胞中的 oHSV-1 T1012G 复制和溶瘤作用中发挥调节作用[2]。

Animal Model:	The subcutaneous xenograft model[2]. (SCC9 or SCC7 cells (8×106 cells or 1×106 cells), 5-week-old, female, BALB/c nude mice or C3H/HeN mice, four groups, n = 6-7, per group)[2]
Dosage:	5 mg/kg
Administration:	GSK2643943A (alone): intraperitoneal administration, daily, for 6 days. GSK2643943A (combination): intraperitoneal administration, daily for 6

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

		days + intratumoral injection with 50 mL of 1×10^6 PFU T1012G in PBS on day 1, day 4, and day 7.
	Result:	Caused a visible drop of tumor volumes and significantly reduced the tumor volumes in mice with combined treatment of GSK2643943A and oHSV-1 T1012G. Increased slightly viral ICP0 and gD mRNA accumulation in SCC9 tumors.
	Animal Model:	The SCC7 mouse model[2].
	Dosage:	2.5 mg/kg
	Administration:	GSK2643943A (alone): intraperitoneal administration, daily, for 9 days. GSK2643943A (combination): intraperitoneal administration, daily, for 9 days + intratumoral injection, with 50 mL of 1×10^7 PFU T1012G in PBS on days 1, 4, 7, and 10.
	Result:	Caused a visible drop of tumor volumes, significantly reduced in mice with combined treatment of GSK and oHSV-1 T1012G. Increased slightly viral ICP0 and gD mRNA accumulation in SCC7 tumors.

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：≥ 125 mg/mL (450.78 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)

	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing Stock Solutions	1 mM	3.6062 mL	18.0310 mL	36.0620 mL
	5 mM	0.7212 mL	3.6062 mL	7.2124 mL
	10 mM	0.3606 mL	1.8031 mL	3.6062 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 (7.50 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 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。

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

	生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂ 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) Solubility: 2.08 mg/mL (7.50 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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。
参考文献	[1]. Nishi Kumari, et al. Targeting the Ubiquitin Proteasome System in Cancer. Shahzad, Hafiz Naveed (2018). Neoplasm Targeting the Ubiquitin Proteasome System in Cancer. , 10.5772/intechopen.69560(Chapter 8). [2]. Ruitao Lu, et al. USP18 and USP20 restrict oHSV-1 replication in resistant human oral squamous carcinoma cell line SCC9 and affect the viability of SCC9 cells. Mol Ther Oncolytics. 2021 Nov 11;23:477-487.

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**	3.6062 mL	18.0310 mL	36.0620 mL	90.1551 mL
	5 mM	0.7212 mL	3.6062 mL	7.2124 mL	18.0310 mL
	10 mM	0.3606 mL	1.8031 mL	3.6062 mL	9.0155 mL
	15 mM	0.2404 mL	1.2021 mL	2.4041 mL	6.0103 mL
	20 mM	0.1803 mL	0.9016 mL	1.8031 mL	4.5078 mL
	25 mM	0.1442 mL	0.7212 mL	1.4425 mL	3.6062 mL
	30 mM	0.1202 mL	0.6010 mL	1.2021 mL	3.0052 mL
	40 mM	0.0902 mL	0.4508 mL	0.9016 mL	2.2539 mL
	50 mM	0.0721 mL	0.3606 mL	0.7212 mL	1.8031 mL
	60 mM	0.0601 mL	0.3005 mL	0.6010 mL	1.5026 mL
	80 mM	0.0451 mL	0.2254 mL	0.4508 mL	1.1269 mL
	100 mM	0.0361 mL	0.1803 mL	0.3606 mL	0.9016 mL