



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: **UNC0379**
CAS 号: **1620401-82-2**
产品货号: **S94740**

生物活性:

Description	UNC0379 is a selective, substrate-competitive inhibitor of lysine methyltransferase SETD8 (KMT5A) with an IC50 of 7.3 μM, KD value of 18.3 μM. UNC0379 can be used in the research of inflammation and cancers, such as pulmonary fibrosis, ovarian cancer, neuroblastoma[1][2][3].			
IC50 & Target	SETD8/KMT5A			
In Vitro	UNC0379 (1-10 μM, 处理 9 天) 能显著抑制高级别浆液性卵巢癌 (HGSOC) 细胞的增殖 [2]。 UNC0379 (10 μM, 处理 96 小时) 可增加 HGSOC 细胞中 Sub-G1 期细胞的比例 [2]。 UNC0379 (10 μM, 处理 48 小时) 可诱导肌成纤维细胞去分化, 并抑制成纤维细胞向肌成纤维细胞的进一步分化 [3]。 Cell Viability Assay[1]			
	Cell Line:	JHOS2, JHOS3, JHOS4, OVCAR3, OVCAHO, OVKATE, KURAMOCHI, TYKnu		
	Concentration:	1-10 μM		
	Incubation Time:	9 days		
	Result:	Inhibited HGSOC cells proliferation withIC50s ranging from 0.39 to 3.20 μM.		
	Cell Cycle Analysis[1]			
	Cell Line:	JHOS3, OVCAR3		
	Concentration:	10 μM		
	Incubation Time:	96 h		
	Result:	Arrested cells in sub-G1 phase.		
In Vivo	UNC0379 (气管内给药, 1 mg/kg/天, 于第 7、8、9 天给药) 可改善博来霉素 (BLM) 诱导的肺纤维化小鼠模型的肺部纤维化程度[3]。 Animal Model: Bleomycin (BLM)-induced lung fibrosis mouse model[3] Dosage: 1 mg/kg/day Administration: Intratracheal administration, on day7, 8, and 9. Result: Ameliorated BLM-induced lung fibrosis (supported by the evaluation of the Ashcroft score and changes in the collagen content in the lung samples) without affecting pulmonary inflammation.			
	Solvent&Solubility	细胞实验:		
		DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (120.90 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)		
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
Preparing Stock Solutions		1 mM	2.4180 mL	12.0901 mL
	5 mM	0.4836 mL	2.4180 mL	4.8361 mL
	10 mM	0.2418 mL	1.2090 mL	2.4180 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, 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。 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 25.0 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 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知)的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例,取 100 μL 25.0 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.05 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中,混合均匀。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.05 mM); 澄清溶液
参考文献	[1]. Ma A, et al. Discovery of a Selective, Substrate-Competitive Inhibitor of the Lysine Methyltransferase SETD8. J Med Chem. 2014 Aug 14;57(15):6822-33. [2]. Miku Wada, et al. Epigenetic Modifier SETD8 as a Therapeutic Target for High-Grade Serous Ovarian Cancer. Biomolecules. 2020 Dec 16;10(12):1686. [3]. Keita Ugai, et al. Inhibition of the SET8 Pathway Ameliorates Lung Fibrosis Even Through Fibroblast Dedifferentiation. Front Mol Biosci. 2020 Aug 5;7:192.
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。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.4180 mL	12.0901 mL	24.1803 mL	60.4507 mL
	5 mM	0.4836 mL	2.4180 mL	4.8361 mL	12.0901 mL
	10 mM	0.2418 mL	1.2090 mL	2.4180 mL	6.0451 mL
	15 mM	0.1612 mL	0.8060 mL	1.6120 mL	4.0300 mL
	20 mM	0.1209 mL	0.6045 mL	1.2090 mL	3.0225 mL
	25 mM	0.0967 mL	0.4836 mL	0.9672 mL	2.4180 mL
	30 mM	0.0806 mL	0.4030 mL	0.8060 mL	2.0150 mL
	40 mM	0.0605 mL	0.3023 mL	0.6045 mL	1.5113 mL
	50 mM	0.0484 mL	0.2418 mL	0.4836 mL	1.2090 mL
	60 mM	0.0403 mL	0.2015 mL	0.4030 mL	1.0075 mL
	80 mM	0.0302 mL	0.1511 mL	0.3023 mL	0.7556 mL
	100 mM	0.0242 mL	0.1209 mL	0.2418 mL	0.6045 mL

源叶