



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: **UNC0224**
CAS 号: **1197196-48-7**
产品货号: **T14792**

生物活性:					
Description	UNC0224 is a potent and selective histone methyltransferase G9a inhibitor with a Ki of 2.6 nM, an IC50 of 15 nM and a Kd of 23 nM. UNC0224 also potently inhibits b>GLP with assay-dependent IC50 values of 20-58 nM. UNC0224 is inactive against SET7/9, SET8/PreSET7, PRMT3 and JMJD2E[1][2].				
IC50 & Target	EHMT1/GLP/KMT1D 20-58 nM (IC50)	G9a 15 nM (IC50)	G9a 2.6 nM (Ki)	G9a 23 nM (Kd)	
In Vitro	在 G9a ECSD 和 CLOT 测定中, UNC0224 (化合物 10) 的 IC50 值分别为 43 nM 和 57 nM。在 GLP ECSD 和 CLOT 测定中, UNC0224 的 IC50 值分别为 50 nM 和 58 nM。在 ITC 实验中, UNC0224 对 G9a 蛋白的 Kd 值为 23 nM[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 16.67 mg/mL (34.32 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	2.0590 mL	10.2951 mL	20.5901 mL
		5 mM	0.4118 mL	2.0590 mL	4.1180 mL
		10 mM	0.2059 mL	1.0295 mL	2.0590 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: ≥ 1.67 mg/mL (3.44 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 16.7 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 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: ≥ 1.67 mg/mL (3.44 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.67 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。				



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

	以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 16.7 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 1.67 mg/mL (3.44 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 1.67 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 16.7 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]. Liu F, et al. Discovery of a 2,4-diamino-7-aminoalkoxyquinazoline as a potent and selective inhibitor of histone lysine methyltransferase G9a. J Med Chem. 2009 Dec 24;52(24):7950-3. [2]. Liu F, et al. Protein lysine methyltransferase G9a inhibitors: design, synthesis, and structure activity relationships of 2,4-diamino-7-aminoalkoxy-quinazolines. J Med Chem. 2010 Aug 12;53(15):5844-57.

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	2.0590 mL	10.2951 mL	20.5901 mL	51.4753 mL
	5 mM	0.4118 mL	2.0590 mL	4.1180 mL	10.2951 mL
	10 mM	0.2059 mL	1.0295 mL	2.0590 mL	5.1475 mL
	15 mM	0.1373 mL	0.6863 mL	1.3727 mL	3.4317 mL
	20 mM	0.1030 mL	0.5148 mL	1.0295 mL	2.5738 mL
	25 mM	0.0824 mL	0.4118 mL	0.8236 mL	2.0590 mL
	30 mM	0.0686 mL	0.3432 mL	0.6863 mL	1.7158 mL