



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: shyyysw@sina.com

产品名称: **UNC0642**
CAS 号: **1481677-78-4**
产品货号: **Y47012**

生物活性:				
Description	UNC0642, a chemical probe, is a potent and selective lysine methyltransferases G9a and GLP inhibitor, with an IC50 of <2.5 nM for G9a.			
IC50 & Target	EHMT2/G9a/KMT1C EHMT1/GLP/KMT1D			
In Vitro	UNC0642 显示出高体外 和细胞效力、低细胞毒性和出色的选择性。UNC0642 与肽底物竞争, 与辅助因子 SAM 不竞争。UNC0642 的 Ki 测定为 3.7±1 nM。UNC0642 对 GLP 表现出高体外效力 (IC50< 2.5 nM), 类似于 G9a。UNC0642 在广泛的激酶、GPCR、转运蛋白和离子通道中对 G9a 和 GLP 的选择性超过 300 倍。UNC0642 在降低 H3K9me2 标记方面表现出高效力, 细胞毒性低, 并且在许多细胞系中功能效力和细胞毒性的良好分离。它降低了胰腺癌细胞系 PANC-1 细胞的克隆形成[1]。			
In Vivo	单次腹膜内 (IP) 注射 (5 mg/kg) UNC0642 可产生 947 ng/mL 的血浆 Cmax (最大浓度) 和 1265 小时的 AUC (曲线下面积) *ng/mL[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (91.46 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
		1 mM	1.8292 mL	9.1458 mL
		5 mM	0.3658 mL	1.8292 mL
		10 mM	0.1829 mL	0.9146 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: ≥ 2.5 mg/mL (4.57 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 ddH ₂ 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: ≥ 2.5 mg/mL (4.57 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (4.57 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。
参考文献	[1]. Liu F, et al. Discovery of an in vivo chemical probe of the lysine methyltransferases G9a and GLP. J Med Chem. 2013 Nov 14;56(21):8931-8942. [2]. Wang L, et al. Targeting EHMT2 reverses EGFR-TKI resistance in NSCLC by epigenetically regulating the PTEN/AKT signaling pathway. Cell Death Dis. 2018 Jan 26;9(2):129

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	1.8292 mL	9.1458 mL	18.2916 mL	45.7289 mL
	5 mM	0.3658 mL	1.8292 mL	3.6583 mL	9.1458 mL
	10 mM	0.1829 mL	0.9146 mL	1.8292 mL	4.5729 mL
	15 mM	0.1219 mL	0.6097 mL	1.2194 mL	3.0486 mL
	20 mM	0.0915 mL	0.4573 mL	0.9146 mL	2.2864 mL
	25 mM	0.0732 mL	0.3658 mL	0.7317 mL	1.8292 mL
	30 mM	0.0610 mL	0.3049 mL	0.6097 mL	1.5243 mL
	40 mM	0.0457 mL	0.2286 mL	0.4573 mL	1.1432 mL
	50 mM	0.0366 mL	0.1829 mL	0.3658 mL	0.9146 mL
	60 mM	0.0305 mL	0.1524 mL	0.3049 mL	0.7621 mL
	80 mM	0.0229 mL	0.1143 mL	0.2286 mL	0.5716 mL