

UNC0642

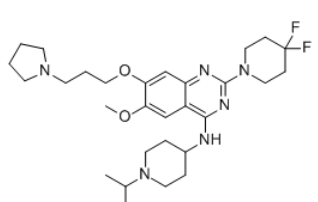
产品编号：MB2642

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG; 25MG

产品形式：白色至类白色(固体)

基本信息

分子式	C ₂₉ H ₄₄ F ₂ N ₆ O ₂	结 构 式	
分子量	546.7		
CAS No.	1481677-78-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：		
	Water：insoluble		
	Ethanol：		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介：UNC0642 是有效地选择性的 G9a/GLP 抑制剂，抑制 G9a 的 IC₅₀ 值小于 2.5 nM。

别名：4-Quinazolinamine,

2-(4,4-difluoro-1-piperidiny)-6-methoxy-N-[1-(1-methylethyl)-4-piperidiny]-7-[3-(1-pyrrolidiny)propoxy]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色(固体)

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL (182.91 mM)；Ethanol 100 mg/mL (182.91 mM)；Water Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	UNC0642 是一种有效的、选择性的 histone methyltransferases G9a/GLP 抑制剂，对 G9a 和 GLP 的 IC ₅₀ 均小于 2.5 nM。对 G9a 和 GLP 的选择性比其他激酶、GPCRs、转运体和离子通道高 300 倍以上。	
靶点	G9a (Cell-free assay)	GLP (Cell-free assay)
	<2.5 nM	<2.5 nM
体外研究	UNC0642 与肽段底物竞争，而与辅因子 SAM 是非竞争性。UNC0642 的 K _i 值为 3.7 ± 1 nM。其对 G9a 和 GLP 的选择性是对其他所检测 13 种甲基转移酶的 20000 倍以上，是对 PRC2-EZH2 的 2000 倍以上。UNC0642 能够高效地减少胞内 H3K9me2 水平、具有低细胞毒性，在 U2OS, PC3 和 PANC-1 细胞中，引起毒性作用的 EC ₅₀ 值与其发挥功能的 IC ₅₀ 之	

	比大于 45。在 PANC01 细胞中，UNC0642 以浓度依赖性方式减少其集落生成，而在 MDA-MB-231 细胞中没有此作用。
体内研究	在 Swiss Albino 小鼠中检测 UNC0642 的体内药代动力学特征，单次腹腔给药(5 mg/kg)后，最大血药浓度 C _{max} 为 947 ng/mL、药物生物利用度 AUC 为 1265 hr*ng/mL。其脑部渗透性能中等，脑/血浆比率为 0.33。单次腹腔注射 5 mg/kg 的 UNC0642 可充分抑制成年小鼠中 G9a 活性。UNC0642 可改善 m ⁺ /p ^{Δ5-U} 小鼠的寿命和体重增加，使 PWS 相关基因长期激活。其耐受良好，不产生明显的急性毒性，不干扰 AS-associated Ube3a 基因的表达。

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。UNC0642 是有效地选择性的 **G9a/GLP** 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8292 mL	9.1458 mL	18.2916 mL
5 mM	0.3658 mL	1.8292 mL	3.6583 mL
10 mM	0.1829 mL	0.9146 mL	1.8292 mL
50 mM	0.0366 mL	0.1829 mL	0.3658 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: MDA-MB-231, PC3 和 U2OS 细胞</p> <p>Concentrations: --</p> <p>Incubation Time: 48 h</p> <p>Method:</p> <p>将 MDA-MB-231, PC3 和 U2OS 细胞培养于含 10% FBS 的 RPMI 培养基中，PANC-1 细胞培养于含 10% FBS 的 DMEM 培养基中。用抑制剂处理细胞 48 小时，检测其细胞活力。</p>
动物实验	<p>Animal Models: male Swiss Albino mice</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 5 mg/kg</p> <p>Administration: i.p.</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M ²)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。