

## 6-硫鸟嘌呤 ; 6-TG ; Thioguanine

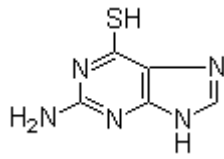
产品编号 : MB1301

质量标准 : >98%,USP,BR

包装规格 : 1G;5G

产品形式 : 淡黄色结晶性粉末

### 基本信息

|              |                               |     |                                                                                     |
|--------------|-------------------------------|-----|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 分子式          | C5H5N5S                       | 结构式 |  |
| 分子量          | 167.19                        |     |                                                                                     |
| CAS No.      | 154-42-7                      |     |                                                                                     |
| 储存条件         | 常温，避光防潮密闭干燥                   |     |                                                                                     |
| 溶解性<br>(25℃) | 在氢氧化钠溶液中易溶                    |     |                                                                                     |
|              | DMSO：17 mg/mL (101.68 mM)     |     |                                                                                     |
|              | 不溶于水、乙醇、三氯甲烷                  |     |                                                                                     |
| 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。     |     |                                                                                     |

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄色结晶性粉末

熔点 : .....> 300 °C (lit.)(dec.)

溶解性 : .....在氢氧化钠溶液中易溶 ; DMSO 17 mg/mL (101.68 mM) ; 不溶于水、乙醇、三氯甲烷

密度 : .....2.08 g/cm<sup>3</sup> (预测)

干燥失重 : .....≤6.0%

含量 : .....96.0~100.5%

IC<sub>50</sub> : .....半数致死剂量 (LD<sub>50</sub>) 经口 - 小鼠 - 160 mg/kg

### 生物活性

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                          |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| 产品描述 | Thioguanine 是一种嘌呤类的抗代谢药物, 抑制了 DNMT1 的活性, 广泛用于治疗急性淋巴细胞白血病, 自身免疫性疾病 (如克罗恩氏病, 类风湿关节炎) 和器官移植接受患者。                                                                                                                                                                            |
| 靶点   | DNMT1                                                                                                                                                                                                                                                                    |
| 体外研究 | Thioguanine 掺入改变在 etoposide 存在和不存在时拓扑异构酶 II 诱导的 DNA 切割。Thioguanine 改变双链 DNA 的结构和降低双链 DNA 的热稳定性, 但在 6SG 可以形成存在双链 DNA。在两个错配修复熟练和缺陷型 HCT116 和 HeLa 细胞中, 6-Thioguanine 诱导在类似的凋亡。6-Thioguanine 能结合到 DNA, 不像典型的 DNA 碱基, 它是一种强的 UVA 的发色团在 342 纳米具有最大吸收。6-Thioguanine 是光敏剂和活性氧源。 |
| 体内研究 | 在异种移植模型中, 6-Thioguanine 是和 PARP 抑制剂一样有效的选择性杀死 BRCA2 缺陷肿瘤。6-Thioguanine 有效杀死 BRCA1 缺陷型 PARP 抑制剂抗性的肿瘤。6-Thioguanine 可以杀死细胞, 肿瘤通过 BRCA2 基因的遗传逆转获得了抗 PARP 抑制剂的抗性。                                                                                                            |

**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。本品属于抑制嘌呤合成途径的常用嘌呤代谢拮抗药物，是细胞周期特异性药物，除能抑制细胞 DNA 的合成外，对 RNA 的合成亦有轻度抑制作用。本品是鸟嘌呤的类似物，在人体内必需由磷酸核糖转移酶转为 6-TG 核糖核苷酸方具活性，本品的作用环节与巯嘌呤相似，此外，6-TG 核糖核苷酸通过对鸟苷酸激酶的抑制作用，可阻止一磷酸鸟苷（GMP）磷酸化为二磷酸鸟苷（GDP）。本品经代谢为脱氧核糖三磷酸后，能掺入 DNA，因而进一步抑制核酸的生物合成，巯嘌呤无此作用。本品与巯嘌呤有效交叉耐药，而与阿糖胞苷等药物合用，可提高疗效。

#### 储液配置

| 体<br>浓度<br>质量<br>积 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      |
|--------------------|-----------|------------|------------|
| 1 mM               | 5.9812 mL | 29.9061 mL | 59.8122 mL |
| 5 mM               | 1.1962 mL | 5.9812 mL  | 11.9624 mL |
| 10 mM              | 0.5981 mL | 2.9906 mL  | 5.9812 mL  |
| 50 mM              | 0.1196 mL | 0.5981 mL  | 1.1962 mL  |

#### 【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(M2) | 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。