

## AG014699 ; Rucaparib phosphate ; Rucaparib ; AG-014699

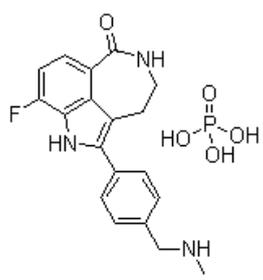
产品编号 : MB1643

质量标准 : >98%;PARP 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : Powder

### 基本信息

分子式	C19H18FN3O.H3PO4	结构式	
分子量	421.36		
CAS No.	459868-92-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 84 mg/mL (199.35 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble		
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:** Rucaparib phosphate 是 **PARP** 抑制剂, 能够抑制 PARP1,  $K_i$  值为 1.4 nM。

**别名:** 瑞卡帕布 ; Rucaparib ; PF-01367338 ; AG014699 phosphate;

8-Fluoro-1,3,4,5-tetrahydro-2-[4-[(methylamino)methyl]phenyl]-6H-pyrrolo[4,3,2-ef][2]benzazepin-6-one phosphate

### 物理性状及指标 :

外观 : .....粉末

溶解性 : .....DMSO: 84 mg/mL (199.35 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 : .....>98%

**储存条件:** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Rucaparib (AG-014699,PF-01367338)是一种 PARP 抑制剂, 无细胞试验中作用于 PARP1 的 $K_i$ 为 1.4 nM, 对其余 8 个 PARP 位点也有结合亲和力。
<b>特性</b>	AG-014699 是第一个用于人类癌症疗法的 PARP 抑制剂。
<b>靶点</b>	PARP (Cell-free assay) 1.4 nM( $K_i$ )
<b>体外研究</b>	AG-014699 有效抑制纯化的全长人类 PARP-1, 作用于 LoVo 和 SW620 细胞显示出强 PARP 抑制效果。AG-014699 是 AG14447 的磷酸盐形式, 且是第一个和 temozolomide 联用于临床实验的 PARP 抑制剂。AG-014699 的辐射增敏性是由于下游 NF- $\kappa$ B 激活的抑制, 及 SSB 修复抑制。AG-014699 可以作用于 DNA 损伤激活的 NF- $\kappa$ B, 且克服传统 NF- $\kappa$ B 抑制剂的毒性, 不会损害其他重要的炎症反应。1 $\mu$ M AG-014699 作用于 D283Med 细胞时抑制 PARP-1 活性达 97.1%。在 NB-1691, SH-SY-5Y, 和 SKNBE(2c)细胞中 AG-014699 明显增强 Topotecan 和 Temozolomide 的细胞毒性

<b>体内研究</b>	AG-014699 无毒, 明显增强 D384Med 移植瘤 DNA 修复功能蛋白中 temozolomide 诱导的 TGD。药物动力学研究显示在脑组织中也检测到 AG-014699, 说明 AG-014699 用于治疗颅内恶性肿瘤具有潜在可能。活体模型(NB1691 和 SHSY5Y 移植瘤)研究显示 AG-014699 增强 temozolomide 的抗癌活性, 产生彻底且持久的肿瘤衰退现象
-------------	---

**美仑相关产品推荐**

MB3749	A-966492
MB3751	AZD2461
MB3747	Iniparib (BSI-201)
CL-10493	INO-1001
MB3748	PJ34.HCl
MB3750	UPF 1069
MB1700	奥拉帕尼

**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。AG-014699 是第一个用于人类癌症疗法的 PARP 抑制剂。可用于相关领域的科学研究。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3733 mL	11.8663 mL	23.7327 mL
5 mM	0.4747 mL	2.3733 mL	4.7465 mL
10 mM	0.2373 mL	1.1866 mL	2.3733 mL
50 mM	0.0475 mL	0.2373 mL	0.4747 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p>激酶实验: 不同浓度(0 到 1<math>\mu</math>)AG-014699 作用于 5<math>\times</math>10<sup>3</sup>D283Med 细胞, 与只用 DMSO 处理 5<math>\times</math>10<sup>3</sup>D283Med 细胞相比, 来测定 PARP 活性抑制率。参考 GCLP 验证试验的 PAR 标准曲线, 在和 NAD<sup>+</sup>及寡核苷酸(底物和激活剂)温育的 6 分钟期间, 使用 10H PAR 抗体, 通过 PAR 形成量的免疫检测, 在细胞样本中测量最大程度刺激的 PARP 活性</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: D425Med, D283Med 和 D384Med 细胞 Concentrations: 0.4 <math>\mu</math>M Incubation Time: 3 或 5 天 Method: 髓母细胞瘤细胞系包含 D425Med, D283Med, 和 D384Med 细胞, 分别按 1<math>\times</math>10<sup>3</sup>, 3<math>\times</math>10<sup>3</sup>, 和 3<math>\times</math>10<sup>3</sup> 密度接种在 96 孔板上。接种 24 小时(D384Med 细胞)或 48 小时(D283Med 和 D425Med 细胞)后, 细胞用不同浓度 temozolomide 处理。培养 3 天(D425Med 和 D384Med 细胞)或 5 天(D283Med 细胞)后, 通过 XTT 细胞增殖检测试剂盒检测细胞活力。用 DMSO 处理的对照组和 0.4<math>\mu</math> AG-014699 处理的实验组的百分比表示细胞生长。计算 temozolomide 单独使用或者和 AG-014699 联用时的 GI50 值。Temozolomide 单独使用时的 GI50 值和与 AG-014699 联用时的 GI50 值之比就是趋化因子 50 (PF50) 值。</p>
<b>动物实验</b>	<p>Animal Models: 携带 D283Med 移植瘤的 CD-1 裸鼠 Formulation: 盐水溶液 Dosages: 1 mg/kg</p>

Administration: 腹腔注射，每天 1 次或 4 次
----------------------------------

**【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 <sup>2</sup> )	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。