

AZD-6738 ; AZD6738

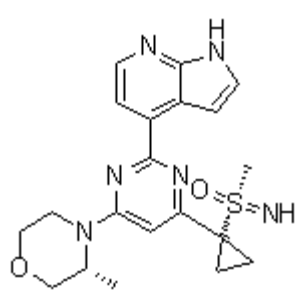
产品编号：MB3527

质量标准：ATR 激酶抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C20H24N6O2S	结构式	
分子量	412.51		
CAS No.	1352226-88-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 82 mg/mL (198.78 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol 41 mg/mL warmed (99.39)		
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： AZD6738 是有效地 ATR 激酶抑制剂，IC₅₀ 值为 1 nM。

别名： 1H-Pyrrolo[2,3-b]pyridine,

4-[4-[1-[[S(R)]-S-methylsulfonimidoyl]cyclopropyl]-6-[(3R)-3-methyl-4- morpholinyl]-2-pyrimidinyl]-

物理性状及指标：

外观：.....浅黄色至卡其色粉末

溶解性：.....DMSO 82 mg/mL (198.78 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 41 mg/mL warmed (99.39 mM)

储存条件： -20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	AZD6738 是一种口服具有活性的，选择性 ATR 激酶抑制剂，IC ₅₀ 为 1 nM。
靶点	ATR
IC50	1 nM
体外研究	在四个 Kras 突变细胞系：H23，H460，A549，和 H358 中，AZD6738 抑制 ATR 激酶活性，并损害细胞活性。在 ATM 缺失的 H23 细胞中，AZD6738 强烈增强顺铂诱导快速细胞死亡的作用。在 p53 或 ATM 缺失的细胞中，AZD6738 治疗引起复制叉停滞和未修复 DNA 损伤的积累，导致有丝分裂障碍，从而使细胞死亡。
体内研究	在负荷 H460 和 H23 肿瘤的裸鼠中，AZD6738 (50 mg/kg, p.o.)导致肿瘤生长抑制(TGI)，结合顺铂引起 ATM 缺失的 H23 肿瘤快速退化。在负荷 LoVo 异种移植物的裸鼠中，AZD6738 (50 mg/kg) + IR (2 Gy)的组合避免了毒性，同时仍保持疗效。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4524	AZ20
--------	------

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。AZD6738 是有效地 ATR 激酶抑制剂, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.4242 mL	12.1209 mL	24.2418 mL
5 mM		0.4848 mL	2.4242 mL	4.8484 mL
10 mM		0.2424 mL	1.2121 mL	2.4242 mL
50 mM		0.0485 mL	0.2424 mL	0.4848 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验 :	<p>Cell lines: H23 , H460 , A549 , 和 H358 细胞</p> <p>Concentrations: ~30 μM</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 细胞在白色壁, 透明底的 96 孔板中与指示剂量的 AZD6738 , cisplatin , gemcitabine , 或它们的组合处理 48 小时。ATP 水平通过 CellTiter-Glo 发光细胞活性试验和 Safire2 酶标仪测量代替品活性评估。进一步分析之前, 原始数据对本底发光进行校正。对于 AZD6738 治疗, 在 GraphPad Prism 6 中将对数转化($x=\log(x)$)的数据归一化为未处理对照组的平均值, 通过非线性回归(log(抑制剂) vs. 对可变斜率的响应值) 生成对数剂量响应曲线。GI50 值, 定义为 $Y = 50\%$ 时, X 的剂量, 根据剂量反应曲线推导得出。</p>
动物实验 :	<p>Animal Models: 负荷 H23 或 H460 异种移植物的雌性无胸腺裸鼠</p> <p>Formulation: 10% DMSO , 40% 丙二醇 , 和 50% 无菌 dH₂O</p> <p>Dosages: 25 或 50 mg/kg</p> <p>Administration: p.o.</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(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。