

VE821 ; VE-821

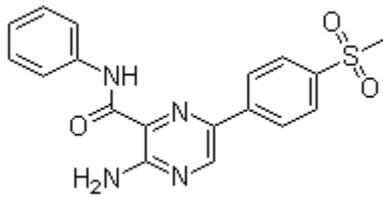
产品编号 : MB3796

质量标准 : >98% , ATR 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C18H16N4O3S	结构式	
分子量	368.41		
CAS No.	1232410-49-9		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 74 mg/mL (200.86 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 : VE-821 是一种有效的 ATP 竞争性的 ATR 抑制剂。

别名 : 3-Amino-6-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-N-phenyl-2-pyrazinecarboxamide, VE821

物理性状及指标 :

外观 :浅绿色至绿色固体

溶解性 :DMSO : 74 mg/mL (200.86 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

产品描述	VE-821 是一种有效的, 选择性的, ATP 竞争性 ATR 抑制剂, 在无细胞试验中 K_i/IC_{50} 为 13 nM/26 nM, 抑制 H2AX 磷酸化, 对 PIKKs ATM, DNA-PK, mTOR 和 PI3K γ 具有很低的抑制活性。		
靶点	<table border="1"> <tr> <td>ATR (Cell-free assay)</td> </tr> <tr> <td>13 nM(K_i)</td> </tr> </table>	ATR (Cell-free assay)	13 nM(K_i)
ATR (Cell-free assay)			
13 nM(K_i)			
体外研究	VE-821 作用于 ATR, 具有优异的选择性, 作用于相关的 PIKKs ATM, DNA-PK, mTOR 和 PI3K, 具有最低的交叉反应性, K_i 分别为 16 μ M, 2.2 μ M, >1 μ M 和 3.9 μ M。VE-821 单独使用, 可使大部分癌细胞群体死亡, 但作用于正常细胞, 只可逆地限制细胞周期进程, 产生最低的死亡或长期的有害影响。VE-821 与 Cisplatin 联合处理, 具有最显著的协同作用。VE-821 抑制 H2AX 细胞生长, IC_{50} 为 800 nM。		

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
--------	------

MB3527

AZD6738

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。VE-821 是 DNA 损伤应答(DDR)激酶 Ataxia telangiectasia-ed(ATM)和 ATM-and Rad3-(ATR)的有效 ATP 竞争抑制剂。VE-821 对相关的 PIKS ATM、DNA 依赖性蛋白激酶(DNA-PK)、mTOR 和 PI3-激酶- γ 的交叉反应性最小, 对大量的不相关蛋白激酶的交叉反应性最小。单独使用 VE-821 在大部分癌细胞群体中导致死亡, 并且还显示出与基因毒剂强烈的协同作用。VE-821 提高了细胞对辐射的敏感性, 并且还使癌细胞对各种化疗药物敏感。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7144 mL	13.5718 mL	27.1437 mL
5 mM	0.5429 mL	2.7144 mL	5.4287 mL
10 mM	0.2714 mL	1.3572 mL	2.7144 mL
50 mM	0.0543 mL	0.2714 mL	0.5429 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶抑制实验: 使用放射性磷酸渗透实验测定化合物抑制 ATR, ATM 或 DNAPK 激酶活性的能力。制备包含适当缓冲液, 激酶和靶点肽的储存液。向其中加入不同浓度溶于 DMSO 的可发生反应的化合物, DMSO 终浓度为 7%。加入适当的γ-³³P]ATP 溶液开始反应, 在 25°C 下温育。经过所需的反应时间过程后, 加入磷酸和 ATP (终浓度分别为 100 mM 和 0.66μM)终止实验。在磷酸纤维素膜上收集肽, 使用 200 μL 100 mM 磷酸洗涤 6 次, 然后加入 100 μL 闪烁混合液, 在 1450 Microbeta 液体闪烁计数器上进行闪烁计数。使用 GraphPad Prism 软件进行剂量-反应数据分析。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: H2AX 细胞 Concentrations: -- Incubation Time: 96 小时 Method: 细胞接种在 96 孔板中, 粘附过夜。第二天, 加入指定浓度的化合物, 终体积为 200μL, 细胞再温育 96 小时。然后加入 MTS 试剂(40μL), 1 小时后, 使用 SpectraMax Plus 384 酶标仪在 490 nm 处测量吸光度。使用 Macsynergy 软件评估协同作用和拮抗作用。</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,使产品沉降到管底。对于液体产品,可以在 200 转左右稍作离心,管底收集液体,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。