

MK-8776; SCH 900776

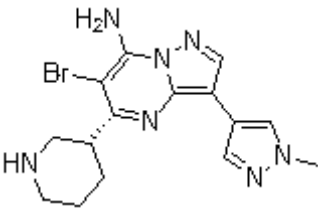
产品编号: MB4042

质量标准: >98%, Chk1 抑制剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C15H18BrN7	结 构 式	
分子量	376.25		
CAS No.	891494-63-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 3 mg/mL 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: SCH900776 是一种有效, 选择性, 可口服的 Chk1 抑制剂, 它比对 CDK2 和 Chk2 的选择性分别高 50 和 500 倍。

别名: MK-8776; Pyrazolo[1,5-a]pyrimidin-7-amine,
6-bromo-3-(1-methyl-1H-pyrazol-4-yl)-5-(3R)-3-piperidinyl

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 3 mg/mL;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	MK-8776 (SCH 900776)是一种选择性 Chk1 抑制剂,无细胞试验中 IC50 为 3 nM,比作用于 Chk2 选择性高 500 倍。	
靶点	Chk1(Cell-free assay) 3 nM	CDK2(Cell-free assay) 0.16 μM
体外研究	SCH 900776 是 Chk2 和 CDK2 的低效抑制剂, IC50 分别为 1.5 μM 和 0.16 μM。SCH 900776 对细胞色素 P450 人肝微粒体亚型 1A2, 2C9, 2C19, 2D6, 和 3A4 没有显著的抑制作用。羟基脲下暴露 24 小时后, SCH 900776 诱导 DNA 复制能力剂量依赖性损失。SCH 900776 增强 γ-H2AX 对羟基脲, 5-氟尿嘧啶, 和阿糖胞苷的响应。与抗代谢物结合, SCH 900776 在 2 小时内诱导 γ-H2AX 的累积, 表明复制叉瓦解, 并且双链 DNA 断裂。此外, SCH 900776 以剂量依赖	

	的方式抑制 Chk1 pS296 自磷酸化的积累。增殖的 WS1 细胞暴露于 SCH 900776, 与 Chk1 pS345 快速的, 剂量依赖性聚集相关, 表明正常细胞的循环群诱导 Chk1 pS345 在暴露于 SCH 900776 后, 是一部分无效循环, 这也许通过 AT-家族激酶和 DNA-PK 驱动。
体内研究	相对于 gemcitabine 或 SCH 900776 单独给药, Gemcitabine 给药 30 分钟后, 4 mg/kg SCH 900776 足以诱导 γ -H2AX 生物标志物, 而 8 mg/kg 增强肿瘤药效动力学和退化响应。递增剂量的 SCH 900776 (16 mg/kg 和 32 mg/kg) 诱导肿瘤响应持续改进。重要的是, 在 BALB/c 小鼠体内, SCH 900776 的剂量与强的生物标志物活化相关, 而提高的肿瘤响应与 gemcitabine 对血液学指标增强的毒性无关。

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)

MB4007	LY2603618
MB4006	AZD7762
Mb4008	CHIR-124

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。MK-8776 (SCH 900776) 是一种选择性 Chk1 抑制剂, 本品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		2.6578 mL	13.2890 mL	26.5781 mL
5 mM		0.5316 mL	2.6578 mL	5.3156 mL
10 mM		-	-	-
50 mM		-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: 皮下注射 A2780 或 MiaPaCa2 细胞的额雌性裸鼠 Formulation: 在 20% 羟丙基 β -环糊精中形成 Dosages: ~50 mg/kg Administration: 腹腔内注射
-------------	--

【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。