

**NSC 69877,7-NO<sub>2</sub>-ICA、CRT0044876**

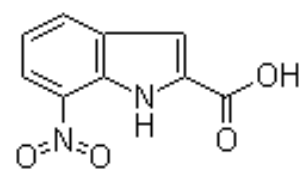
产品编号：MB4133

质量标准：>98%,BR

包装规格：20MG;100MG

产品形式：solid

**基本信息**

分子式	C <sub>9</sub> H <sub>6</sub> N <sub>2</sub> O <sub>4</sub>	结 构 式	
分子量	206.15		
CAS No.	6960-45-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 41 mg/mL (198.88 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 1 mg/mL (4.85 mM)		
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：**CRT0044876 是一种强效的选择性的 APE1 抑制剂。

**别名：**7-Nitro-1H-indole-2-carboxylic acid, 7-Nitroindole-2carboxylic acid, NSC 69877

**物理性状及指标：**

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 41 mg/mL (198.88 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 1 mg/mL (4.85 mM)

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>	CRT0044876 是一种强效的选择性的 APE1 抑制剂，其 IC <sub>50</sub> 约为 3μM。
<b>靶点</b>	APE1 ~3 μM
<b>体外研究</b>	CRT0044876 显著抑制 APE1 的脱嘌呤嘧啶内切核酸酶，3'端磷酸二酯酶和 3'端磷酸酯酶活性，对抑制核酸外切酶 III 家族具有选择性。CRT0044876 增强几种靶向 DNA 碱基的化合物的毒性，导致未配对的 AP 位点积累。CRT0044876 通过抑制 BER 信号通路增加氧化 DNA 损伤，进而增加酸性的肿瘤微环境中细胞外的活性氧，导致细胞周期抑制和增加 DNA

双链断裂，最终导致细胞死亡。

**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。CRT0044876 靶向脱嘌呤核酸内切酶（APE1）活性位点并抑制其 3'-磷酸二酯酶和 3'-磷酸酶活性 - 切除修复中的必要步骤 - 对内切核酸酶 IV，BamH1 限制性内切酶或拓扑异构酶 I 的影响最小，即使浓度高至 100 $\mu$ M。在非细胞毒性浓度下，CRT0044876 增强了几种 DNA 碱基靶向化合物的细胞毒性，并具有脱嘌呤位点的积累。本品可用于相关肿瘤治疗领域科研试剂。

#### 储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	4.8508 mL	24.2542 mL	48.5084 mL
5 mM	0.9702 mL	4.8508 mL	9.7017 mL
10 mM	0.4851 mL	2.4254 mL	4.8508 mL
50 mM	0.0970 mL	0.4851 mL	0.9702 mL

#### 经典实验操作（仅供参考）

<b>激酶实验</b>	<p><b>AP 位点裂解实验:</b>                      BER 反应缓冲液中包含 40 mM HEPES-KOH (pH 7.8), 5 mM MgCl<sub>2</sub>, 0.5 mM DTT 和 0.1 mM EDTA。一个 10 <math>\mu</math>l 体系的 AP 位点裂解反应包含 BER 缓冲液混合物, 纯化的蛋白 (3.3 nM APE1 终浓度) 和 0.75 ng 还原的 AP 位点双链核苷酸。混合液在 37 摄氏度孵育 1 小时。加入 1<math>\mu</math>l 终止液(50% 丙三醇, 10 mM 三羟甲基氨基甲烷盐酸盐, 1 mM EDTA, 0.1%溴酚蓝 以及 0.1%二甲苯蓝)。混合液在 90 到 100 摄氏度中变性 2 分钟。然后样品在 15% TBE Criterion™ Pre-Cast Gel 上跑, 电泳在 30mA 电流下进行 30 分钟, 用磷光成像仪观测放射性标记的底物和反应产物。潜在 APE-1 靶向化合物的抑制活性用 0.1 到 100 <math>\mu</math>M 浓度的药物来测定。用 ImageQuant 软件来分析来量化已分解的放射性条带。IC50 值是计算抑制 50%APE1 活性时的抑制剂浓度。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> HT1080 纤维肉瘤细胞  <b>Concentrations:</b> 100-500 <math>\mu</math>M  <b>Incubation Time:</b> 7-10 天  <b>Method:</b>                      HT1080 纤维肉瘤细胞在含有 2% RPMI 培养基[补充青霉素 0.06 g/l, 链霉素 0.1 g/l (pH 7.0), 10% 胚胎牛血清和 4 mM 谷氨酰胺]中生长。只有集落形成率<math>\geq</math>60%的细胞才用作克隆存活分析。以 500 个细胞每盘接种于组织培养皿 (10 厘米), 培养基在维持于 37 摄氏度, 5%二氧化碳和 95%空气的潮湿培养箱中培养。为了评估 APE1 抑制剂的毒性, 加入不同浓度(100-500 <math>\mu</math>M)的抑制剂到培养基中, 培养 7 到 10 天直到细胞集落形成。将菌落用[75% (v/v) 甲醇 25% (v/v) 乙酸]固定 30 分钟, 室温下, 结晶紫染色 4 小时。用克隆计数器计数可</p>

见的菌落。

**【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，否则会严重影响化合物活性，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。