

TH-588 ; TH588

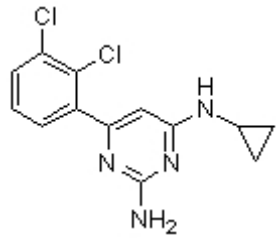
产品编号：MB4167

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;20MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C13H12Cl2N4	结 构 式	
分子量	295.17		
CAS No.	1609960-31-7		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 20 mg/mL warmed (67.75 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 1 mg/mL warmed (3.38 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：TH588 是 MTH1(NUDT1)高效选择性抑制剂。

别名：2,4-Pyrimidinediamine, N4-cyclopropyl-6-(2,3-dichlorophenyl)-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 20 mg/mL warmed (67.75 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 1 mg/mL warmed (3.38 mM)

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	TH588 是一种有效的选择性 MTH1 (NUDT1)抑制剂，IC50 为 5 nM。在浓度为 100 μM 时，对所检测的其他蛋白没有相关抑制作用，但是在 10 μM 时，对另外一些酶、GPCRs、激酶、离子通道和转运体有一定的选择性。
靶点	MTH1(cell-free assay) 5 nM
体外研究	TH588 选择性杀死 U2OS 和其它癌细胞系，对几个初级或无限增殖的细胞毒性较弱。TH588 也会诱导 U2OS 细胞中 DNA 损伤，并引起 ATM-p53 介导的死亡应答和 DNA 修复。
体内研究	负荷 SW480 结肠或 MCF7 乳腺癌异种移植物的 小鼠体内，TH588 (30 mg/kg s.c.)通过抑制 MTH1 减少肿瘤生长。在携带患者 BRAFV600E 突变异种移植物的 小鼠体内，TH588 (30 mg/kg s.c.)也会引起肿瘤生长率降低。

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)

MB4163	TH287
MB4161	(S)-crizotinib

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。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		3.3879 mL	16.9394 mL	33.8788 mL
5 mM		0.6776 mL	3.3879 mL	6.7758 mL
10 mM		0.3388 mL	1.6939 mL	3.3879 mL
50 mM		0.0678 mL	0.3388 mL	0.6776 mL

经典实验操作（仅供参考）

动物实验	<p>Animal Models: 负荷 SW480 异种移植或 MCF-7 异种移植物的 SCID 小鼠；负荷患者 BRAFV600E 突变异种移植物的 NOD-SCID IL2Rγ^{null} (NOG) 小鼠。</p> <p>Formulation: 2% DMSO, 10% ethanol, 10% cremaphore, 10% Tween 80, 68% PBS; 10% N-methylpyrrolidone, 90% PEG300</p> <p>Dosages: 30 mg/kg, 每天一次</p> <p>Administration: s.c.</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。