

**SGI-1776 ; SGI1776**

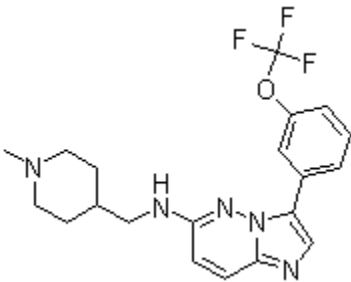
产品编号 : MB5142

质量标准 : &gt;98% , Pim1 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

**基本信息**

分子式	C20H22F3N5O	结 构 式	
分子量	405.42		
CAS No.	1025065-69-3		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 81 mg/mL (199.79 mM)		
	Ethanol : 81 mg/mL (199.79 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 :** SGI-1776 是一种 Pim 抑制剂, 抑制 Pim-1 , Pim-2 和 Pim-3 的活性。**别名 :** Imidazo[1,2-b]pyridazin-6-amine, N-[(1-methyl-4-piperidyl)methyl]-3-[3-(trifluoromethoxy)phenyl]-**物理性状及指标 :**

外观 : .....白色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 81 mg/mL (199.79 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 81 mg/mL (199.79 mM)

含量 : .....&gt;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>	SGI-1776 是新型的, ATP 竞争性的 Pim1 抑制剂, IC50 为 7 nM,比作用于 Pim2 和 Pim3 选择性分别高 50 和 10 倍,也有效作用于 Flt3 和 haspin。			
<b>靶点</b>	Pim1	Pim2	Pim3	FLT3
<b>IC50</b>	7 nM	0.363 uM	69 nM	44 nM

<b>体外研究</b>	除了 Pim, SGI-1776 也有效作用于 FLT3 (IC50 = 44nM)。SGI-1776 处理 AML 细胞, 诱导细胞凋亡, 这种作用存在浓度依赖性。SGI-1776 作用于 AML 原代细胞, 具有毒性, 且导致 Mcl-1 蛋白降低。SGI-1776 处理 CLL 细胞, 诱导细胞凋亡, 这种作用存在剂量依赖性。SGI-1776 作用于 CLL, 诱导凋亡, 作用机理涉及到 Mcl-1 减少。SGI-1776 处理的 CLL 细胞中, 观察到诱导凋亡, 伴随着 RNA 合成受抑制。在体外, SGI-1776 具有毒性, 且平均相对 IC50 值为 3.1 mM。相反, SGI-1776 诱导完整的皮下 MV4;11 反应。
<b>体内研究</b>	SGI-1776 有效作用于携带 MV-4-11 肿瘤的小鼠模型。SGI-1776 作用于白血病和实体瘤细胞系, 具有临床前期活性, IC50 为 0.005-11.68 mM。在体内, SGI-1776 作用于 31 分之 9 的实体移植瘤和 8 分之 1 的 ALL 移植瘤, 显著诱导 EFS 分布中的分化。
<b>特征</b>	SGI-1776 是治疗 CLL 的潜在试剂, 进一步强调了 MCL-1 在 CLL 的重要性。

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)

MB4062	SMI-4a
MB6975	AZD1208

**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。SGI-1776 是一种 Pim 抑制剂, 抑制 Pim-1, Pim-2 和 Pim-3 的活性。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	2.4666 mL	12.3329 mL	24.6658 mL
5 mM	0.4933 mL	2.4666 mL	4.9332 mL
10 mM	0.2467 mL	1.2333 mL	2.4666 mL
50 mM	0.0493 mL	0.2467 mL	0.4933 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	进行辐射检测测量激酶抑制情况。检测实验含肽底物, 已知纯化的重组人类激酶, gamma-标记的 ATP, Mg <sup>2+</sup> , 及混合浓度(1 μmol/L) SGI-1776。在终体积为 25 μL 的反应中, 5 到 10 mU Pim1/2/3 与 8 mmol/L MOPS, pH 7.0; 0.2 mmol/L 乙二胺四乙酸; 100 μM KKRNRTLTV; 10 mM MgAcetate; 及 [γ- <sup>32</sup> P-ATP] 温育。加入 MgATP 混合物开始反应。在室温下温育 40 分钟, 加入 5 μL 3% 磷酸溶液终止反应。10 μL 反应转移到 P30 过滤板上, 在 75 mmol/L 磷酸中冲洗 3 次, 持续 5 分钟, 然后在甲醇中清洗 1 次, 然后烘干, 使用闪烁计数器测量。
<b>细胞实验</b>	<b>Cell lines:</b> MV-4-11, MOLM-13, 和 OCI-AML-3 细胞系

	<p><b>Concentrations:</b> 0.1, 0.3, 1, 3, 或 10<math>\mu</math>M  <b>Incubation Time:</b> 24 小时  <b>Method:</b> 细胞培养在含 10% FBS 的 IMDM (ATCC)培养基中, 然后生长在 37<math>^{\circ}</math>C 含 5% CO<math>_2</math> 环境下。使用购买的试剂盒对支原体感染的细胞做常规检测。使用 DMSO 或不同浓度 SGI-1776 处理细胞 24 小时。冲洗细胞(<math>1 \times 10^6</math>),然后再悬浮在 100 <math>\mu</math>L 膜联蛋白结合 buffer 中, 与 5 <math>\mu</math>L FITC 溶液及 5 <math>\mu</math>L 碘化丙啶(PI;50 <math>\mu</math>g/mL)溶液混合。每组样本中,使用 Becton Dickinson FACSCalibur 流式细胞仪测量 <math>1 \times 10^4</math> 个细胞。</p>
动物实验	<p><b>Animal Models:</b> 雌性 NOD-SCID 小鼠  <b>Formulation:</b> 5% 葡萄糖  <b>Dosages:</b> 75 mg/kg 和 200 mg/kg  <b>Administration:</b> 口服处理</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(M $^2$ )	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。