

**MK-4827 (Niraparib) ; MK4827 (Niraparib)**

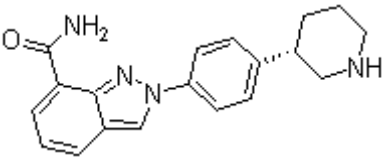
产品编号 : MB5556

质量标准 : &gt;98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : powder

**基本信息**

分子式	C19H20N4O	结 构 式	
分子量	320.39		
CAS No.	1038915-60-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 64 mg/mL (199.75 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol 64 mg/mL (199.75 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 :** Niraparib (MK-4827) 是高效的 PARP1 和 PARP2 抑制剂。**别名 :** 尼拉帕尼 ; MK-4827 ; 2H-Indazole-7-carboxamide, 2-[4-(3S)-3-piperidinylphenyl]-**物理性状及指标 :**

外观 : .....白色至棕色固体

溶解性 : .....DMSO 64 mg/mL (199.75 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 64 mg/mL (199.75 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>	Niraparib (MK4827)是一种口服有效的选择性 PARP-1 和 PARP-2 抑制剂, 可在有 BRCA 和 PTEN 功能缺陷的临床肿瘤模型中引起合成致死性。	
<b>靶点</b>	PARP2 (Cell-free assay)	PARP1 (Cell-free assay)
	2.1 nM	3.8 nM

<b>体外研究</b>	在完整细胞试验中，MK-4827 抑制 PARP 的活性，EC50 为 4 nM，并抑制携带 BRCA-1 和 BRCA-2 突变的癌细胞的增殖，IC50 为 10-100 nM。它能有效地抑制 PARP-1 和 PARP-2，IC 分别为 3.8 nM 和 2.1 nM。它对 PARP-3, V-PARP 和 tankyrase-1 的选择性低 100 倍以上，IC50 分别为 1300、330、570 nM。MK-4827 能够抑制携带有天然 BRCA-1 和 BRCA-2 突变的癌细胞的增殖、通过 RNA 干扰抑制 BRCA-1 缺陷的 Hela 细胞的生长。在携带 BRCA-1 突变的 MDA-MB-436 人类乳腺癌的细胞中，MK-4827 的 CC50=18 nM；而在 BRCA-2 缺陷的 CAPAN-1 人胰腺癌细胞中，CC50=90 nM。而正常人类前列腺和乳腺上皮细胞对 MK-4827 具有耐药性，在微摩尔范围内具有抗凋亡作用，说明这些 PARP 抑制剂在具有 BRCA-1 和 BRCA-2 突变的癌细胞中具有选择性细胞毒性，对周围组织影响小。
<b>体内研究</b>	MK-4827 能够显著增强辐射对人类肿瘤移植体（p53 野生型或 p53 突变型）的效果。在体内实验中，其耐受良好。单独使用时，在 BRCA-1 缺陷型移植瘤模型中具有一定功效。

**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)**

MB3751	AZD2461
MB3747	Iniparib (BSI-201)
MB1700	Olaparib,AZD2281,KU0059436

**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。Niraparib (MK-4827) 是高效的 PARP1 和 PARP2 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.1212 mL	15.6060 mL	31.2120 mL
5 mM	0.6242 mL	3.1212 mL	6.2424 mL
10 mM	0.3121 mL	1.5606 mL	3.1212 mL
50 mM	0.0624 mL	0.3121 mL	0.6242 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> BRCA1 基因沉默的 Hela 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 系列稀释浓度</p> <p><b>Incubation Time:</b> 7 天</p> <p><b>Method:</b> 将细胞置于 96 孔黑色 viewplates 中，细胞密度为 300/孔，每孔含 190 <math>\mu</math>L DMEM 培养基(含 10%胎牛血清，0.1 mg/mL 青-链霉素双抗，2 mM L-谷氨酰胺)，在 37°C、5% CO<sub>2</sub> 的细胞培养箱中培养 4 小时。将系列稀释的抑制剂加入其中，每孔 10 <math>\mu</math>L，使化合物浓度达到工作浓度、DMSO 为 0.5%。然后在细胞在细胞培养箱中培养 7 天。7 天后，测定细胞活</p>
-------------	----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

	力。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 雌性裸鼠 <b>Formulation:</b> 0.5% 甲基纤维素 <b>Dosages:</b> 25 mg/kg 每日两次或 50 mg/kg 每日一次 <b>Administration:</b> 口服

**【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。