

## SGI1027; SGI-1027

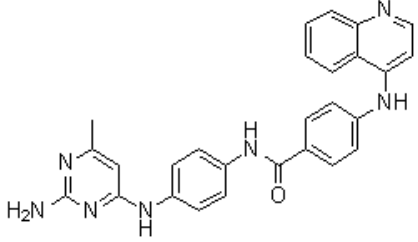
产品编号: MB7449

质量标准: >98%,DNMT 抑制剂

包装规格: 10MG;100MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C27H23N7O	结 构 式	
分子量	461.52		
CAS No.	1020149-73-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 92 mg/mL (199.34 mM) 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:** SGI-1027 是 DNA 甲基转移酶 (DNMT) 抑制剂, 对以 poly(dI-dC) 为底物的 DNMT3B, DNMT3A 和 DNMT1 有抑制效果。

**别名:** Benzamide, N-[4-[(2-amino-6-methyl-4-pyrimidinyl)amino]phenyl]-4-(4-quinolinylamino)-

### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

溶解性: .....DMSO 92 mg/mL (199.34 mM); 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

<b>产品描述</b>	SGI-1027 是一种 DNMT 抑制剂, 作用于 DNMT1, DNMT3A 和 DNMT3B, 无细胞试验中 IC50 分别为 6, 8 和 7.5 μM。		
<b>特性</b>	潜在用于后生癌症的治疗。		
<b>靶点</b>	DNMT1 (Cell-free assay) 6 μM	DNMT3B (Cell-free assay) 7.5 μM	DNMT3A (Cell-free assay) 8 μM
<b>体外研究</b>	SGI-1027 通过直接抑制 DNMTs 而抑制 DNA 甲基化, 并导致 DNMT1 在各种人癌细胞系中选择性降解。SGI-1027 在大鼠肝癌 H4IIE 细胞中表现出很小或没有毒性作用。SGI-1027 (0-100 μM) 在 U937 人白血病细胞系中表现出适度的促凋亡作用, 而在细胞周期中没有相关变化		

**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-1027 是一种 DNMT

抑制剂，作用于 DNMT1, DNMT3A 和 DNMT3B, 本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 积 浓度	质 量 1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1668 mL	10.8338 mL	21.6675 mL
5 mM	0.4334 mL	2.1668 mL	4.3335 mL
10 mM	0.2167 mL	1.0834 mL	2.1668 mL
50 mM	0.0433 mL	0.2167 mL	0.4334 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p>DNA 甲基转移酶(CpG 甲基转移酶) 试验:</p> <p>DNA 甲基化酶的活性通过使用修改过的 DE-81 离子交换过滤器试验, 测量 Ado-Met 的 3H1 甲基组与 DNA 的整合而测定。重组人 DNMT1, 重组小鼠 Dnmt3a/ Dnmt3b (500 纳克)与 500 纳克 poly(dI-dC)或半甲基化 DNA 双链和 75 或 150 nM (0.275<math>\mu</math>Ci 或 0.55<math>\mu</math>Ci)的[甲基-3H]- 腺苷甲硫氨酸(Ado-Met), 总体积为 50 微升, 在 37°C下培育 1 小时。M. Sss I 在供体缓冲液中进行测试。加入指示浓度的 SGI-1027 或 decitabine。每个反应重复两份进行, 包括不含抑制剂或 DNA 的对照组。在 Whatman DE-81 离子交换过滤器上浸透反应混合物停止反应, 清洗(5 次, 每次 10 分钟, 用 0.5M 磷酸钠缓冲液; pH 7.0)干燥, 并在闪烁计数器上计数。从包含 DNA 的反应混合物得到的值中减去背景放射性(无 DNA 的对照组), 不含任何抑制剂的反应得到的放射性作为 100% 活性。IC50 通过百分比活性相对于抑制剂浓度的曲线图确定。为测定 SGI-1027 对 DNMTase 活性的抑制, 在固定浓度抑制剂(0, 2.5, 5, 和 10<math>\mu</math>M)存在下, 测定 DNMT1 酶的活性, 而两个中的一个(Ado-Met 或 DNA)在特定反应混合物中变化。在固定 DNA 浓度(500 纳克)下, Ado-Met 的浓度变化范围为 25-500 nM。同样的, 75 nM Ado-Met 下, 最终 DNA 浓度变化范围为 25-500 纳克。</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: 大鼠肝癌 H4IIE 细胞</p> <p>Concentrations: ~300 <math>\mu</math>M</p> <p>Incubation Time: 48 小时</p> <p>Method: 大鼠肝癌 H4IIE 细胞用作测试系统。这些细胞在 DMEM 中生长, 用胎牛血清(10%)和小牛血清(10%)进行增补。将细胞接种在 96 孔板, 48 小时后, 暴露于 0 到 300 微摩尔/升浓度的 SGI-1027。溶解性通过 Nephelometry 技术在给药后立即测定, 并在 24 小时收集细胞前进行测定。经过曝光后, 分析细胞或者它们的上层清液(培养基)在细胞分化(碘化丙啶), 膜渗漏(<math>\alpha</math>-GST), 线粒体功能[3-(4,5-二甲基吡啶-2-yl)-2,5-二苯基溴和细胞内 ATP], 氧化应激(细胞内 GSH 和 8-异前列腺), 以及细胞凋亡中的改变。半数最大毒性浓度(TC50)通过级量反应曲线确定。</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。