

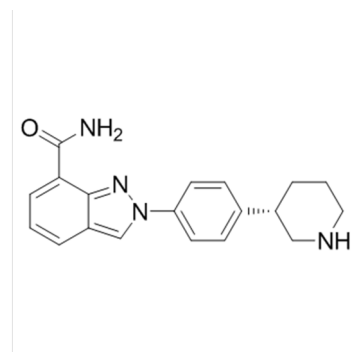
MK4827 (RARP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6682-10mM	MK4827 (RARP抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6682-5mg	MK4827 (RARP抑制剂)	5mg
SC6682-25mg	MK4827 (RARP抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-[4-[(3S)-piperidin-3-yl]phenyl]indazole-7-carboxamide
简称	MK4827
别名	Niraparib, MK 4827, MK-4827, Niraparib hydrochloride
中文名	N/A
化学式	C ₁₉ H ₂₀ N ₄ O
分子量	320.39
CAS号	1038915-60-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 34mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.56ml DMSO, 或每3.20mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6682-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	MK-4827 (Niraparib) is a selective inhibitor of PARP1/PARP2 with IC ₅₀ of 3.8nM/2.1nM; with great activity in cancer cells with mutant BRCA-1 and BRCA-2; >330-fold selective against PARP3, V-PARP and Tank1.				
信号通路	Cell Cycle; DNA Damage				
靶点	PARP1	PARP2	—	—	—
IC ₅₀	3.8nM	2.1nM	—	—	—
体外研究	MK-4827 displays excellent PARP 1 and 2 inhibition with IC(50)=3.8 and 2.1nM, respectively, and in a whole cell assay, it inhibits PARP activity with EC(50)=4nM and inhibits proliferation of cancer cells with mutant BRCA-1 and BRCA-2 with CC(50) in the 10-100nM range.				
体内研究	MK-4827 is well tolerated in vivo and demonstrates efficacy as a single agent in a xenograft model of BRCA-1 deficient cancer. In addition, MK-4827 strongly enhances the effect of radiation on a variety of human tumor xenografts, both p53 wild type and p53 mutant. The enhancement of radiation response is observed in clinically relevant radiation-dose fractionation schedules. The therapeutic window during which time MK-4827 interacts with radiation lasts for several hours. These biological attributes make translation of this therapeutic combination treatment feasible for translation to the treatment of a variety of human cancers.				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	N/A

配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

1. Jones P, et al. J Med Chem. 2009 Nov 26, 52(22), 7170-85.
2. Wang L, et al. Invest New Drugs. 2012 Dec, 30(6), 2113-20.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6682-10mM	MK4827 (RARP抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6682-5mg	MK4827 (RARP抑制剂)	5mg
SC6682-25mg	MK4827 (RARP抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01