

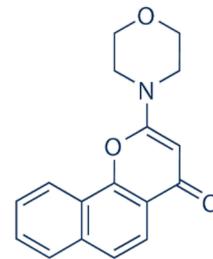
NU7026 (DNA-PK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC9150-10mM	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC9150-5mg	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	5mg
SC9150-25mg	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-morpholin-4-ylbenzo[h]chromen-4-one
简称	NU7026
别名	2-(morpholin-4-yl)benzo(h)chromen-4-one, NU 7026, NU-7026, LY-293646, LY293646, LY 293646
中文名	N/A
化学式	C ₁₇ H ₁₅ NO ₃
分子量	281.31
CAS号	154447-35-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 3mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.78ml DMSO, 或每2.81mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC9150-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	NU7026是一种有效的DNA-PK抑制剂, 在无细胞试验中IC ₅₀ 为0.23μM, 作用于DNA-PK比作用于PI3K选择性高60倍, 对ATM和ATR没有抑制活性。				
信号通路	DNA Damage; PI3K/Akt/mTOR				
靶点	DNA-PK	PI3K	ATM	ATR	—
IC ₅₀	0.23μM	13μM	>100μM	>100μM	—
体外研究	NU7026剂量依赖性增强V3YAC和PARP-1+/+细胞中电离辐射诱导的细胞毒性。NU7026完全废止生长阻滞细胞中潜在致死性损伤的恢复。NU7026抑制V3YAC细胞系中56%的DNA DSB修复。在K562细胞中, NU7026(10μM)增强idarubicin、daunorubicin、doxorubicin、etoposide、mAMSA和mitoxantrone的生长抑制作用, PF50值范围大约为19(对mAMSA)到2(对idarubicin)。NU7026(10μM)也会增强白血病细胞中etoposide的生长抑制作用, PF50值为10.53。NU7026(10μM)增强K562细胞中etoposide诱导的细胞周期G2期阻滞。NU7026增强topo II的毒性, 包括对非同源末端连接的抑制和G2/M检查点阻滞。在CH1人卵巢癌细胞中, NU7026(10μM)暴露4小时结合3 Gy辐射对显著的电波敏化作用是必需的。在CLL细胞系(I83)和初级CLL-淋巴细胞中, NU7026(<10μM)与chlorambucil在NU7026的无毒剂量下具有协同的细胞毒活性。NU7026(10μM)增加I83细胞中chlorambucil诱导的G(2)/M期阻滞。在I83细胞中, NU7026(10μM)增强整个细胞周期中chlorambucil诱导的γH2AX。NU7026(10μM)增加I83细胞系中chlorambucil诱导的细胞凋亡。NU7026(55μM)导致p53缺失的MEFs中显著的端粒融合诱导, 并导致p53和连接酶IV双重缺失的MEFs中端粒融合更少。				
体内研究	NU7026(20mg/kg, i.v.)在小鼠体内具有快速的血浆清除率(0.108/小时), 这在很大程度上归因于广泛的代谢。NU7026以20mg/kg的剂量腹腔(i.p.)内或口服给药后的生物利用度分别为20和15%。				
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	哺乳动物DNA-PK(500ng/μl)通过HeLa细胞核提取物使用Q-琼脂糖, S-琼脂糖和肝素琼脂糖层析后分离。DNA-PK(250ng)的活性在30°C下, 40μl终体积, 包含25mM HEPES(pH 7.4), 12.5mM MgCl ₂ , 50mM KCl, 1mM DTT, 10% v/v 甘油, 0.1% w/v NP-40和1mg底物GST-p53N66的缓冲液中, 聚丙烯96孔板上测量。将不同浓度的NU7026(在DMSO中终浓度为1% v/v)加入试验混合物。培育10分钟后, 加入终浓度

	为50 μ M 的ATP, 以及30-mer双链DNA寡核苷酸(终浓度0.5ng/ml), 以起始反应。摇晃1个小时后, 将150 μ l PBS加入反应, 然后将5 μ l转移到每孔包含45 μ l PBS的96孔不透明白色板, 并允许GSTp53N66底物与孔结合1小时。所有酶测定中化合物的IC50s由S形曲线使用图形软件包Prism得到, 其中不同浓度化合物下的酶活性对化合物浓度作图。
--	-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

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	雌性BALB/c小鼠
配制	10% DMSO和5% Tween 20的生理盐水溶液
剂量	25mg/kg
给药方式	腹腔注射或口服

➤ **参考文献:**

- 1.Veuger SJ, et al. Cancer Res, 2003, 63(18), 6008-6015.
- 2.Willmore E, et al. Blood, 2004, 103(12), 4659-4665.
- 3.Nutley BP, et al. Br J Cancer, 2005, 93(9), 1011-1018.
- 4.Amrein L, et al. J Pharmacol Exp Ther, 2007, 321(3), 848-855.
- 5.Williams ES, et al. Cancer Res, 2009, 69(5), 2100-2107.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC9150-10mM	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC9150-5mg	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	5mg
SC9150-25mg	NU7026 (DNA-PK抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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