

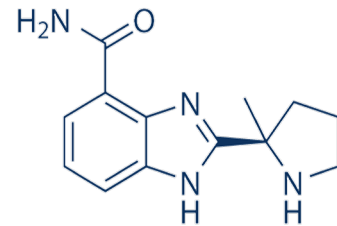
Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0020-10mM	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0020-5mg	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	5mg
SC0020-25mg	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-[(2R)-2-methylpyrrolidin-2-yl]-1H-benzimidazole-4-carboxamide
简称	Veliparib
别名	ABT-888, ABT888, ABT 888
中文名	N/A
化学式	C ₁₃ H ₁₆ N ₄ O
分子量	244.29
CAS号	912444-00-9
纯度	100.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 17mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入2.05ml DMSO, 或者每2.44mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0020-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Veliparib(ABT-888)是一种有效的PARP1和PARP2抑制剂,无细胞试验中Ki分别为5.2nM和2.9nM,对SIRT2没有活性。Phase 3。				
信号通路	DNA Damage				
靶点	PARP2	PARP1	—	—	—
IC50	2.9nM(Ki)	5.2nM(Ki)	—	—	—
体外研究	ABT-888有效抑制PARP,作用于PARP-1和PARP-2时Ki值分别为5.2和2.9nM。ABT-888降低肺癌H460细胞中克隆基因的存活率,且抑制DNA修复。ABT-888抑制C41细胞,EC50为2nM。ABT-888和放射物联用减少肿瘤血管的形成。				
体内研究	ABT-888推迟NCI-H460移植瘤模型的肿瘤生长。ABT-888在B16F10和9L移植瘤模型中抑制PARP,从而增强temozolomide的抗癌活性。ABT-888和其他细胞毒素药剂联用于MX-1移植瘤模型时显示出强抗癌效力。在A375和Colo829移植瘤模型中按肿瘤大小,每千克分别加3和12.5mg ABT-888,可以看到肿瘤内95%以上PAR被抑制。				
临床实验	N/A				
特征	ABT-888增强常见癌症疗法的效果,比如放射疗法和烷基化剂。				

➤ 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	在含有50mM Tris(pH为8.0)、1mM DTT和4mM MgCl ₂ 的缓冲溶液中进行酶活性测定。PARP反应包含1.5μM [³ H]-NAD ⁺ (1.6μCi/mmol)、200nM生物素组蛋白H1、200nM siDNA及1nM PARP-1或4nM PARP-2酶。在加有100μl反应液的96孔板上进行SPA检测。在50μl含有PARP和DNA的2×酶液混合物中加入50μl 2×NAD ⁺ 基底混合物,反应开始。加入150μl 1.5mM苯甲酰胺反应停止。170μl反应终止液转移到链霉素和素包被的闪烁镀层上,温育1小时,用微型板闪烁计数器计数。

细胞实验	
细胞系	C41细胞
浓度	10μM左右
处理时间	0.5小时
方法	在96孔板上用ABT-888处理C41细胞0.5小时。用1mM H ₂ O ₂ 破坏DNA 10分钟,PARP被激活。用冰冻的PBS

	冲洗细胞，然后用预冷的甲醇/丙酮(按7:3比例混合)在-20°C下固定10分钟。风干后，用PBS再溶解，然后用溶有5%脱脂奶粉的PBS-Tween封闭液(0.05%)在室温下阻断0.5小时。细胞和PAR抗体按1:50比例在封闭液中室温下温育1小时，然后用PBS-Tween-20冲洗5分钟，然后加入荧光素-5(6)-异硫氰酸酯(FITC)-联用的二抗和1µg/ml DAPI封闭液中室温下温育1小时。PBS-Tween-20冲洗5分钟后，用荧光微型版计数器分析数据。
--	---

动物实验	
动物模型	携带NCI-H460、H460、B16F10和9L移植瘤的C57BL/6鼠
配制	在含0.9% NaCl溶液中配制，调节pH为4.0
剂量	25或3.125mg/kg
给药方式	口服处理

➤ **参考文献:**

1. Rees DD, et al. Br J Pharmacol. 1990; 101(3):746-752.
2. Albert JM, et al. Clin Cancer Res. 2007; 13(10):3033-3042.
3. Donawho CK, et al. Clin Cancer Res. 2007; 13 (9):2728-2737.
4. Kinders RJ, et al. Clin Cancer Res. 2008; 14(21):6877-6885.
5. Penning TD, et al. J Med Chem. 2009; 52(2):514-523.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0020-10mM	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0020-5mg	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	5mg
SC0020-25mg	Veliparib (ABT-888) (PARP1抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

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降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、体内研究结果或其它相关文献，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 2016.12.12