

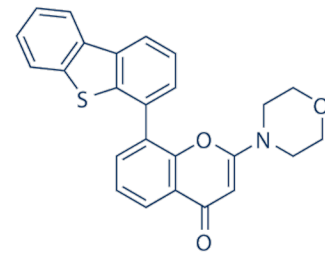
## NU-7441 (DNA-PK抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC9154-10mM	NU-7441 (DNA-PK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC9154-5mg	NU-7441 (DNA-PK抑制剂)	5mg
SC9154-25mg	NU-7441 (DNA-PK抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	8-dibenzothiophen-4-yl-2-morpholin-4-ylchromen-4-one
简称	NU-7441
别名	KU57788, NU 7441, NU7441, KU-57788, KU 57788
中文名	N/A
化学式	C <sub>25</sub> H <sub>19</sub> NO <sub>3</sub> S
分子量	413.49
CAS号	503468-95-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1.2mg/ml; DMSO 4.8mg/ml; Ethanol <1.2mg/ml
溶液配制	5mg加入1.21ml DMSO, 或每4.13mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC9154-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	NU7441 (KU-57788)是一种高度有效的, 选择性DNA-PK抑制剂, 在无细胞试验中IC <sub>50</sub> 为14nM, 也会抑制PI3K, IC <sub>50</sub> 为5μM。				
信号通路	DNA Damage; PI3K/Akt/mTOR				
靶点	DNA-PK	mTOR	PI3K	ATM	ATR
IC <sub>50</sub>	14nM	1.7μM	5μM	>100μM	>100μM
体外研究	NU7441抑制DNA依赖性蛋白激酶(DNA-PK)比抑制其他PI3K相关激酶(PIKK)家族成员选择性高, IC <sub>50</sub> 为14nM。电离辐射诱导或Etoposide诱导DNA损伤后, 1μM NU7441提高γH2AX病灶的持久性。NU7441浓度为0.5μM或1μM时, 作用于SW620和LoVo细胞, 显著提高电离辐射, Etoposide和Doxorubicin诱导的G2-M累积增多。NU7441浓度为1μM时, 引起Doxorubicin和电离辐射诱导的DNA双链断裂的持久性, 也稍微降低同源重组活性DNA-PK充足的M059-Fus-1和DNA-PK缺陷的M059 J人类肿瘤细胞。NU7441浓度为10μM时, 作用于缺乏和表达polη的细胞, 抑制UV诱导RPA p34过度磷酸化。NU7441浓度为1μM时, 作用于慢性淋巴细胞性白血病细胞。提高Fludarabine诱导的γH2AX病灶水平, 也相应地降低Fludarabine诱导的细胞死亡。NU7441浓度为1μM时, 作用于慢性淋巴细胞性白血病细胞, 抑制Mitoxantrone诱导的DNA-PKcs自磷酸化和修复。				
体内研究	NU7441按10mg/kg剂量腹腔注射处理携带SW620移植瘤的小鼠, 按无毒剂量处理至少4小时, 然后提高Etoposide诱导的肿瘤生长延迟2倍。				
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	SW620, LoVo, V3-YAC和V3细胞
浓度	0.5μM或1μM
处理时间	17小时
方法	通过克隆实验测定NU7441, Etoposide, Doxorubicin和电离辐射作用于SW620, LoVo, V3和V3-YAC细胞存活的效果。在有或无NU7441(0.5或1.0μM)存在时, 使用Etoposide或Doxorubicin处理6孔板或6cm盘

	中指数生长的细胞16小时。放射增敏研究中，NU7441加到细胞中，1小时后，使用辐射处理。使用 $\gamma$ -射线(3.1Gy/min 137Cesium)处理V3和V3-YAC细胞。使用可用设备，使用X-射线(2.9Gy/min, 230 kV, 10mA)处理SW620和LoVo细胞。辐射处理后，在有或无NU7441存在时，细胞再温育16小时。胰蛋白酶消化，收集细胞，计数，然后按每盘100到 $10^5$ 的密度接种在10cm直径的Petri盘中，盘中含无药物培养基，用于形成集落。使用结晶紫对集落进行染色，10到14天后，使用自动集落计数器计数。
--	---

动物实验	
动物模型	携带SW620移植瘤的雌性裸鼠
配制	无菌0.9% NaCl溶液
剂量	10mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

1. Leahy JJ, et al. Bioorg Med Chem Lett, 2004, 14(24), 6083-6087.
2. Zhao Y, et al. Cancer Res, 2006, 66(10), 5354-5362.
3. Tavecchio M, et al. Cancer Chemother Pharmacol, 2012, 69(1), 155-164.
4. Cruet-Hennequart S, et al. DNA Repair (Amst), 2006, 5(4), 491-504.
5. Willmore E, et al. Clin Cancer Res, 2008, 14(12), 3984-3992.
6. Elliott SL, et al. Br J Haematol, 2011, 152(1), 61-71.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC9154-10mM	NU-7441 (DNA-PK抑制剂)	10mM×0.2ml
SC9154-5mg	NU-7441 (DNA-PK抑制剂)	5mg
SC9154-25mg	NU-7441 (DNA-PK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