

Danusertib ; PHA739358

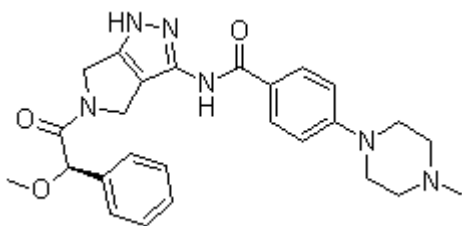
产品编号 : MB3898

质量标准 : >98% , Aurora kinase 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₃₀ N ₆ O ₃	结 构 式	
分子量	474.55		
CAS No.	827318-97-8		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 95 mg/mL 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 : 达鲁舍替 Danusertib 是一种极光激酶 (aurora kinase) 抑制剂, 能够抑制 Aurora A , Aurora B 和 Aurora C 的活性。

别名 : PHA739358;达鲁舍替; N-[5-((2R)-2-Methoxy-2-phenylethanoyl)-1,4,5,6-tetrahydropyrrolo[3,4-c]pyrazol-3-yl]-4-(4-methylpiperazin-1-yl)benzamide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 95 mg/mL ; 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

产品描述	Danusertib (PHA-739358)是一种 Aurora kinase 抑制剂, 作用于 Aurora A/B/C, 无细胞试验中 IC50 为 13 nM/79 nM/61 nM, 适度有效作用于 Abl, TrkA, c-RET 和 FGFR1, 对 Lck, VEGFR2/3, c-Kit, CDK2 等作用效果稍弱。				
靶点	Aurora A (Cell-free assay)	Abl (Cell-free assay)	RET (Cell-free assay)	TrkA (Cell-free assay)	FGFR1 (Cell-free assay)

	13 nM	25 nM	31 nM	31 nM	47 nM
体外研究	Danusertib 也抑制其他激酶活性，比如作用于 FGFR1, Abl, Ret 和 Trka 时 IC50 分别为 47, 25, 31, 和 31 nM。Danusertib 处理野生型 MEFs 和 p53 缺陷型 MEFs 后，野生型细胞在有丝分裂 (4N) 时遭到抑制，停滞 48 小时，而 p53 缺陷型细胞在 DNA 为 4N 时不被抑制，持续有丝分裂，DNA 变为 >8N。Danusertib 处理导致 p53 蛋白水平的上升，也引起 p21 蛋白增多，p53 在转录水平上调节 p21 蛋白。				
体内研究	体内研究时，25 mg/kg Danusertib 静脉注射到 HL-60 移植瘤鼠中，抑制 75% 的肿瘤生长。在体内，Danusertib 导致生物标记性的调节，伴随着肿瘤生长的合适抑制和 aurora 激酶活性机制的预期抑制。				

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4004	CCT137690
MB3998	CYC116
MB3898	Danusertib (PHA-739358)

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。Danusertib (PHA-739358) 是一种 Aurora kinase 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1073 mL	10.5363 mL	21.0726 mL
5 mM	0.4215 mL	2.1073 mL	4.2145 mL
10 mM	0.2107 mL	1.0536 mL	2.1073 mL
50 mM	0.0421 mL	0.2107 mL	0.4215 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶实验: ATP 和特定底物的 Km 值最先就确定好，每次实验时按最佳 ATP(2Km)浓度和底物(5Km)浓度进行。这样设置便于直接比较横穿应用激酶选择性扫描板的 Danusertib IC50 值，用于选择性概况的评估。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: CD34+细胞 Concentrations: 5 μM Incubation Time: 5 天</p>

	<p>Method: 用于短期扩展实验, 103 CD34+细胞按分三组接种在包含 96 孔板上, 板上每孔包括 100ul 无血清培养基, 悬浮着人类肝细胞因子(100 ng/ml), 人类 Flt-3 配位体(100 ng/ml), 人类促血小板生成素 (50 ng/ml), 人类 IL-3 和 IL-6 (都为 20 ng/ml), 粒细胞集落刺激因子(20 ng/ml)及 Danusertib。5 天后, 加入含 100 μl 细胞因子和 Danusertib 的培养基。在第 3, 6, 和 9 天, 或者第 3, 6, 和 12 天测量每孔中的细胞数。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 雌性 SCID 鼠 Formulation: DMSO Dosages: 15 mg/kg Administration: 腹腔注射</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
狻狻	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。