

AT9283

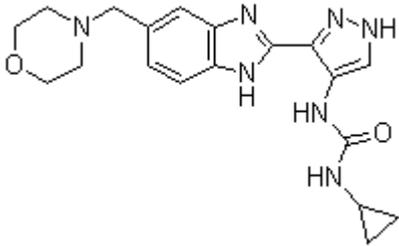
产品编号：MB3927

质量标准：>98%，JAK2/3 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C19H23N7O2	结 构 式	
分子量	381.43		
CAS No.	896466-04-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 76 mg/mL (199.25 mM) Water Insoluble Ethanol : 38 mg/mL (99.62 mM)		
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：AT9283 是一种多靶点激酶抑制剂，有效抑制 Aurora A/B，JAK2/3 等。

别名：Urea, N-cyclopropyl-N'-[3-[6-(4-morpholinylmethyl)-1H-benzimidazol-2-yl]-1H-pyrazol-4-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 76 mg/mL (199.25 mM);Water Insoluble;Ethanol : 38 mg/mL (99.62 mM)

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	AT9283 是一种有效的 JAK2/3 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 1.2 nM/1.1 nM；对 Aurora A/B，Abl(T315I)也有效。						
特性	AT9283 是有效的 pan-aurora 抑制剂。						
靶点	JAK3	JAK2	Aurora	A	Aurora	B	Abl1 (T315I)

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	1.1 nM	1.2 nM	~3.0 nM	~3.0 nM	4 nM
体外研究	在体外, AT9283 有效抑制多种激酶, 包括 Aurora A, Aurora B, JAK3, JAK2 和 Abl, IC50 分别为 3 nM, 3 nM, 1.1 nM, 1.2 nM 和 4 nM。AT9283 作用于 HCT116 细胞, 通过抑制 Aurora B 激酶活性, 产生明显的多倍体表现型, IC50 为 30 nM。而且, AT9283 也有效抑制 HCT116 形成集落。				
体内研究	AT9283 按 15 mg/kg 和 20 mg/kg 剂量作用于携带 HCT116 人结肠癌移植瘤的小鼠, 持续 16 天, 显著抑制肿瘤生长, 抑制分别达 67%和 76%。此外, 与血浆(半衰期为 0.5 小时)相比, AT9283 口服给药小鼠, 也具有显著较长的半衰期。				

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)

MB3925	WP1066
MB4568	BMS-911543
MB3929	CEP-33779
MB3923	Fedratinib (SAR302503, TG101348)

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。AT9283 是一种多靶点激酶抑制剂, 有效抑制 Aurora A/B, JAK2/3 等。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	2.6217 mL	13.1086 mL	26.2171 mL
5 mM	0.5243 mL	2.6217 mL	5.2434 mL
10 mM	0.2622 mL	1.3109 mL	2.6217 mL
50 mM	0.0524 mL	0.2622 mL	0.5243 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	Aurora A 和 Aurora B 激酶实验: 在 DELFIA 格式中进行 Aurora A 和 B 实验。Aurora A 酶和 AT9283 及 3 μM 肽底物 (生物素-CGPKGPGRRRRRRTSSFAEG) 在 10 mM MOPS, pH 7, 0.1 mg/mL BSA, 0.001% Brij-
--------------	----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------

	<p>35, 0.5% 甘油, 0.2 mM EDTA, 10 mM MgCl₂, 0.01% β-巯基乙醇, 15 μM ATP和 2.5% DMSO 混合物中温育。Aurora B 酶和 AT9283,及 3 μM 以上底物在 25 mM Tris, pH 8.5, 5 mM MgCl₂, 0.1 mg/mL BSA, 0.025% Tween-20, 1 mM DTT, 15 μM ATP, 和 2.5% DMSO 的混合物中温育。Aurora A 和 Aurora B 反应分别进行 60 分钟和 45-90 分钟,然后使用 EDTA 进行淬灭。反应混合物转移到亲和素包被的实验板上, 通过时间分辨荧光技术(激发波长, 337 nm;发射波长, 620 nm), 使用特定磷酸抗体和铕标记的二抗测量磷酸化的肽。</p>
细胞实验 :	<p>Cell lines: HCT 116 细胞 Concentrations: 1 nM 到 10 μM Incubation Time: 72 小时 Method: HCT 116 细胞培养在 DMEM +10% FBS + GLUTAMAX I 中。细胞接种在黑色 96 孔平底组织培养板中, 孔中含 200 μL 培养基, 在 37°C 下温育约 16 小时, 在湿润且含 5% CO₂ 的环境下温育约 16 小时。使用 9 种不同浓度 AT9283 (为 1 nM 到 10 μM, 对照组为 DMSO) 处理细胞, 然后再温育 72 小时。标记对细胞多倍体形态学的观察。记录产生明显多倍体所需 AT9283 的浓度。细胞按 75-100 个细胞/mL 接种在有关培养基中, 然后转移到 6-或 24-孔组织培养板上, 然后覆盖培养 16 小时。AT9283(11 种浓度, 0.1 nM 到 10 μM) 或对照组(DMSO) 加到复制孔中, DMSO 终浓度为 0.1%。随后加入 AT9283, 集落生长 10 和 14 天, 计算最佳离散菌落数。集落在 2 mL Carnoys 固定液(25% 乙酸, 75% MeOH)中固定, 然后在 2 mL 0.4% w/v 结晶紫中染色。计算每孔中集落数。使用 Prism Graphpad 软件绘制 IC₅₀ 曲线, 通过 S 形剂量反应曲线计算 IC₅₀ 值。</p>
动物实验 :	<p>Animal Models: 后腿侧皮下注射 HCT116 细胞的雄性 BALB/c 小鼠 Formulation: 溶于 10% DMSO, 20% 水, 70% 羟丙基-β-环糊精 (25% w/v aq) Dosages: 15 mg/kg 和 20 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
狒狒	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。