

## BX-912 ; BX912

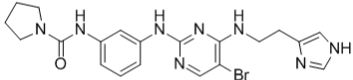
产品编号：MB3973

质量标准：>98%,BR

包装规格：MG ; G

产品形式：白色至类白色固体

### 基本信息

分子式	C20H23BrN8O	结 构 式	
分子量	471.35		
CAS No.	702674-56-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 94 mg/mL (199.42 mM)		
	Water: 94 mg/mL (199.42 mM)		
	Water 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：** BX-912 是一种有效的 PDK1 抑制剂，IC<sub>50</sub> 为 12 nM。

### 别名：

N-[3-[[5-bromo-4-[[2-(1H-imidazol-5-yl)ethyl]amino]-2-pyrimidinyl]amino]phenyl]-1-pyrrolidinecarboxamide

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO 94 mg/mL (199.42 mM);Ethanol 94 mg/mL (199.42 mM);Water Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：** -20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	BX-912 是一种有效的，特异性的 PDK1 抑制剂，无细胞试验中 IC <sub>50</sub> 为 12 nM，作用于 PKD1 比作用于 PKA 和 PKC 选择性分别高 9 和 105 倍。与 GSK3β 相比，对 PDK1 的选择性是 600 倍。				
<b>靶点</b>	PDK-1 (Cell-free assay)	PKA (Cell-free assay)	KDR (Cell-free assay)	CDK2/CyclinE (Cell-free assay)	Chk1 (Cell-free assay)
	12 nM	110 nM	410 nM	650 nM	830 nM
<b>体外研究</b>	BX912 抑制 ChcK1,PKA,c-kit,和 KDR IC <sub>50</sub> 分别为 0.83, 0.11, 0.85, 和 0.41 μM。BX912 作用于肿瘤细胞，阻断 PDK1/Akt 信号，在培养中也抑制多种肿瘤细胞的贴壁依赖型生长(比如 PC-3 细胞)或者诱导凋亡。许多癌细胞系(比如 MDA-468 乳腺癌)具有提高的 Akt 活性，在软				

	琼脂中培养的组织对 BX912 的敏感性比在组织培养塑料上高 30 多倍, 和 PDK1/Akt 信号通路的细胞生存一致, 这对没有粘附的细胞尤其重要。BX912 有效抑制 PDK1 酶活, 但是不抑制 AKT2 活性(IC50>10 μM)。因此, BX-912 是 PDK1 的直接抑制剂。BX912 是 PDK1 活性的竞争性抑制剂, BX912 结合到 PDK1 的 ATP 结合袋中。BX912 的氨基嘧啶骨架采用与 PDK1 激活位点相似的位点。BX912 显著提高的含 4 N DNA 的 MDA-468 细胞数, 且使细胞停在 G2/M 期。BX912 也有效抑制 HCT-116 细胞生长, 按 1 μM 剂量处理抑制率达 96%。BX912 有效抑制细胞生长, IC50 为 0.32μM。
--	---

**美仑相关产品推荐**

MB3974	BX-795
MB1370	PS48
MB3972	GSK2334470
CL-11214	KP372-1(PDK1/Akt/Flt Dual Inhibitor)

**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。BX-912 是一种有效的 **PDK1** 抑制剂, 可作为相关领域的科研实验试剂。

**储液配置 :**

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.1216 mL	10.6078 mL	21.2157 mL
5 mM	0.4243 mL	2.1216 mL	4.2431 mL
10 mM	0.2122 mL	1.0608 mL	2.1216 mL
50 mM	0.0424 mL	0.2122 mL	0.4243 mL

**经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>激酶实验:</b> 直接激酶法测定 PDK1, 耦合法测定 PDK1 和磷脂酰肌醇-3,4-P2 调节的 AKT2 激活。联合实验中, 60 μL 终实验混合物包括: 15 mM MOPS, pH 为 7.2, 1 mg/mL 牛血清白蛋白, 18 mM β-甘油磷酸, 0.7 mM 二硫苏糖醇, 3 mM EGTA, 10 mM MgOAc, 7.5 μM ATP, 0.2 μCi[γ-<sup>33</sup>P]ATP, 7.5 μM 生物素化的肽底物(生物素-ARRRDGGGAQPFRPRAATF), 0.5 μL 含磷脂小泡的磷脂酰肌醇 3,4-P2, 60 pg 纯化的重组人类 PDK1, 及 172 ng 纯化的重组人类 AKT2。室温下温育 2 小时后, 生物素标签的肽段从 10 μL 实验混合物中转移到链酶亲和素包被的 SPA 珠中, 在 Wallac MicroBeta 计数器上测定产物。形成的产物和温育时间及加入的 PDK1 和未激活的 AKT2 量相关。加入非合适量的 PDK1, 用来测定 AKT2 抑制剂激活, 及 PDK1 或 AKT2 的抑制剂 BX912。测定 PDK1 活性, 60 μL 终实验混合物包括 50 mM Tris-HCl, pH 为 7.5, 0.1 mM EGTA, 0.1 mM EDTA, 0.1% β-巯基乙醇, 1 mg/mL BSA, 10 mM MgOAc, 10 μM ATP, 0.2 μCi[γ-<sup>33</sup>P]ATP, 7.5 μM 肽底物(H2N-ARRRGVTTKTFCGT), 60 ng 纯化的重组人类。室温下温育 4 小时, 加入 25 mM EDTA, 在 P81 磷酸纤维素纸上染色一部分反应混合物。滤纸用 0.75% 磷酸冲洗三次, 用丙酮冲洗一次。烘干后, 使用感光成像仪测定肽段。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> MDA-468, MDA-453 <b>Concentrations:</b> 0.001-1 μM <b>Incubation Time:</b> 72 小时</p>

<b>Method:</b> 细胞系包括 MDA-468,MDA-453 等按每孔 $1.5-3 \times 10^3$ 个细胞接种在 96 孔板上 过夜。每孔加入溶于 1% DMSO 和生长培养基(DMSO 最终浓度为 0.1%)的 10 $\mu$ L BX912, 震荡处理。细胞温育 72 小时, 加入 10 $\mu$ L 代谢染料测定活力。在 450 nm 处测定 WST-1 信号。
---

**【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。