

CYC116

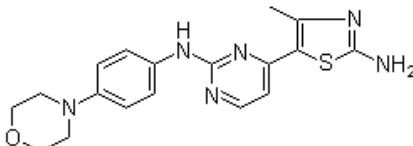
产品编号：MB3998

质量标准：>98%，Aurora A/B 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C18H20N6OS	结 构 式	
分子量	368.46		
CAS No.	693228-63-6		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO : 24 mg/mL warmed (65.13 mM)		
	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： CYC-116 是有效的极光激酶 A 和 B (aurora A/B) 的抑制剂。

别名： 2-Pyrimidinamine, 4-(2-amino-4-methyl-5-thiazolyl)-N-[4-(4-morpholinyl)phenyl]-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO：24 mg/mL warmed (65.13 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

储存条件： -20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	CYC116 是一种有效的 Aurora A/B 抑制剂， K_i 为 8.0 nM/9.2 nM，对 VEGFR2(K_i 为 44 nM)作用稍弱，比作用于 CDKs 效果强 50 倍，对 PKA，Akt/PKB，PKC 没有活性，对 GSK-3 α/β ，CK2，PIK1 和 SAPK2A 没有抑制效果。				
特性	CYC116 是口服生物有效性的，小分子 Aurora 激酶/VEGFR2 抑制剂。				
靶点	Aurora A (Cell-free assay)	Aurora B (Cell-free assay)	VEGFR2 (Cell-free assay)	FLT3 (Cell-free assay)	CDK2/CyclinE (Cell-free assay)
	8 nM(K_i)	9 nM(K_i)	44 nM(K_i)	44 nM(K_i)	0.39 μ M(K_i)
体外研究	CYC116 有效抑制 Aurora A 和 B 激酶，效果比作用于任何 CDKs 都高 50 多倍，作用于 Aurora A 和 B 的 K_i 分别为 8.0 和 9.2 nM。使用 MTT 抗增殖实验测定 CYC116 作用于一组人类白血病和实体瘤细胞系，结果显示 CYC116 具有广谱抗癌效果，尤其显示作用于急性粒细胞性白血病细胞系 MV4-11 时 IC50 为 34 nM。此外，CYC116 的抗增殖活性与 Aurora A 和 B 调节相关，比如抑制 Aurora 自磷酸化，组蛋白 H3 磷酸化和多倍性降低，随后由于细胞质不能分裂导致细胞死亡。				

体内研究	CYC116 口服给药皮下注射 NCI-H460 移植瘤的小鼠，持续 5 天，按剂量 75 和 100 mg/kg 每天口服处理，导致肿瘤生长分别延迟 2.3 和 5.8 天。
------	--

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)

MB4002	TAK-901
--------	---------

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。CYC116 是一种有效的 Aurora A/B 抑制剂，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7140 mL	13.5700 mL	27.1400 mL
5 mM	0.5428 mL	2.7140 mL	5.4280 mL
10 mM	0.2714 mL	1.3570 mL	2.7140 mL
50 mM	0.0543 mL	0.2714 mL	0.5428 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	激酶实验： 使用 25 μL 反应体积(25 mM β-甘油磷酸, 20 mM Tris/HCl, pH 7.5, 5 mM EGTA, 1 mM DTT, 1 mM Na_3VO_4, 10 μg kemptide(肽底物)), 和稀释在含 0.5 mg/mL BSA, 2.5% 甘油和 0.006% Brij-35 的 20 mM Tris/HCl 中的重组 Aurora A 激酶稀释 (pH 为 8) 进行 Aurora A 激酶实验。加入 5 μL Mg/ATP 混合物 (15 mM MgCl_2, 100 μM ATP, 及每孔含 18.5 kBq γ-^{32}P-ATP), 在 30°C 下温育 30 分钟, 加入 25 μL 75 mM H_3PO_4 终止反应。
细胞实验	Cell lines: HeLa, MCF7, MV4-11 和 A2780 细胞 Concentrations: 0 到 10 μM Incubation Time: 72 或 96 小时 Method: 进行标准 MTT 实验。细胞接种在 96 孔板上, 在 37°C 下温育过夜。实验混合物溶解在 DMSO 中, 连续稀释 3 倍, 储备于 100 μL 细胞培养基中, 加到细胞中, 重复 2 次, 在 37°C 下温育 72 或 96 小时。MTT 溶于细胞培养基中, 浓度为 5 mg/mL, 溶液过滤消毒。从细胞中移除培养基, 然后用 PBS 冲洗。每孔加入 20 μL MTT 溶液, 然后在 37°C 下黑暗温育 4 小时。移除 MTT 溶液, 细胞再次用 200 μL PBS 冲洗。每孔用 200 μL DMSO 搅动溶解 MTT 染料。在 540 nm 处读取吸光值, 使用曲线拟合软件分析数据, 用于测定 IC50 值。
动物实验	Animal Models: 腹腔注射 NCI-H460 细胞的小鼠 Formulation: CYC116 溶于 DMSO, 然后用水稀释。 Dosages: 75 和 100 mg/kg Administration: 口服处理

【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

品质变质;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。