

CCT137690

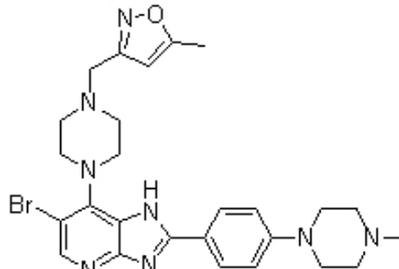
产品编号：MB4004

质量标准：>98%，Aurora A, Aurora B 和 Aurora C 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₆ H ₃₁ BrN ₈ O	结 构 式	
分子量	551.48		
CAS No.	1095382-05-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 4 mg/mL (7.25 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：CCT 137690 是有效的，有口服活性的极光激酶 (aurora) 抑制剂，作用于极光激酶 A, B, C。

别名：3H-Imidazo[4,5-b]pyridine,

6-bromo-7-[4-[(5-methyl-3-isoxazolyl)methyl]-1-piperazinyl]-2-[4-(4-methyl-1-piperazinyl)phenyl]-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至卡其色固体

溶解性：.....DMSO : 4 mg/mL (7.25 mM) ; 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	CCT137690 是高选择性 Aurora A, Aurora B 和 Aurora C 抑制剂，IC ₅₀ 分别为 15 nM, 25 nM 和 19 nM，对 hERG 离子通道几乎没有作用效果。		
靶点	Aurora-A	Aurora-B	Aurora-C
IC₅₀	15 nM	25 nM	19 nM
体外研究	CCT137690 作用于多种人类肿瘤细胞系具有抗增殖活性，包括 SW620 结肠癌细胞和 A2780 卵巢癌细胞，GI ₅₀ 分别为 0.3 和 0.14 μM。此外 CCT137690 也抑制组蛋白 H3 的磷酸化作用。CCT137690 抑制主要的细胞色素 P450 亚型(CYP1A2,CYP2A6,CYP2C9,CYP2C19,CYP2D6,CYP3A4)，IC ₅₀ 值大 10 μM。然而，CCT137690 是 hERG 离子通道的适度抑制剂，IC ₅₀ 为 3.0 μM。CCT137690 有效抑制人类不同器官肿瘤细胞系的生长，GI ₅₀ 值为 0.005 到 0.47 μM。CCT137690 完全抑制 Aurora A 在 T288 位点自磷酸化，0.5 μM 时也且抑制组蛋白 H3 磷酸化。CCT137690 作用于 HCT116 细胞，诱导多倍体，有丝分裂畸变，凋亡。CCT137690 作用于 KELLY 成神经细胞瘤细胞系，降低 MYCN 水平，和 GSK3β 磷酸化。CCT137690 抑制 FLT3 自磷酸化，和下游靶点 STAT5 和 p44/42 MAPK(Erk1/2)的磷酸化。CCT137690 作用于 FLT3-ITD 阳性		

	AML, 抑制 Aurora 和 FLT3 激酶, 诱导凋亡, 且导致细胞周期呈现为在 G2/M 期累积。
体内研究	体内, 口服处理 CCT137690, 抑制 SW620 结肠癌移植瘤的生长, 且没有明显的细胞毒性。在转基因鼠成神经细胞瘤模型中过量表达 MYCN 蛋白, 且易自发形成成神经细胞瘤, CCT137690 明显抑制肿瘤生长。此外, CCT137690 有效抑制皮下 MOLM-13 移植瘤, 且没有明显毒性, 体重也没降低。
特征	CCT137690 是口服有效性的抑制剂, 具有合理的药物动力学参数。

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)

MB4003	GSK1070916
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。CCT 137690 是有效的, 有口服活性的极光激酶 (aurora) 抑制剂, 作用于极光激酶 A, B, C。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8133 mL	9.0665 mL	18.1330 mL
5 mM	0.3627 mL	1.8133 mL	3.6266 mL
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶实验: 使用 384 孔基础板[®]作为固体实验平板。用溶于 PBS 的 100 µg/mL 二硫苏糖醇(DTT)包被板, 在 4 °C 下过夜, 用 PBS 冲洗两次后使用。溶于 2% DMSO 的 5 µL CCT137690 加到每孔中, 随后加入 15 µL 激酶(50 mM Tris pH 为 7.5, 10 mM NaCl, 2.5 mM MgCl₂, 1 mM 髓鞘碱性蛋白 (MBP), 20 µM ATP, 及 0.025 µCi/µL ³³P-ATP)。最后, 每孔加入 250 ng Aurora-A 酶。震荡 2 分钟, 然后在室温下温育 2 小时。用 10 mM 焦磷酸钠冲洗板两次 终止反应。在 TopCount-NXT™ 读数。测定 CCT137690 作用于 Aurora-B 或 Aurora-C 的抑制活性, 实验条件相同, 使用 Aurora-B 或 Aurora-C 酶。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: SW620, A2780, 和 HCT116 细胞 Concentrations: 0 到 50µM Incubation Time: 72 小时 Method: 使用比色分析 MTT 实验分析 CCT137690 作用于细胞增殖的效果。人类结肠癌细胞系(HCT116, Colo205, SW620, HT29, KW12)按每孔 2.5×10³个细胞接种在 96 孔板上, 用 0 到 50µM 梯度浓度 CCT137690 处理 72 小时。使用 Wallac VICTOR2™ 1420 多标记计数器在 570 nm 处测定吸光值。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 SW620 人类结肠瘤的雌性 CrTac:NCr-Fox1(nu)无胸腺鼠 Formulation: DMSO-Tween-盐水</p>

Dosages: 75 mg/kg

Administration: 口服处理，每天两次，持续 21 天。

【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，请选择用合适溶剂 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。