

PHA-793887

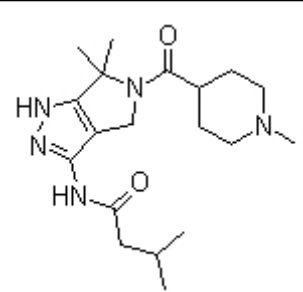
产品编号：MB4025

质量标准：>98%，CDK2,CDK5 和 CDK7 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C19H31N5O2	结构式	
分子量	361.48		
CAS No.	718630-59-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：72 mg/mL (199.18 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol：72 mg/mL (199.18 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：PHA-793887 是一种有效的，ATP 竞争性的 CDK 抑制剂，可抑制 Cdk2，Cdk1，Cdk4 和 Cdk9 的活性。

别名：Butanamide, 3-methyl-N-[1,4,5,6-tetrahydro-6,6-dimethyl-5-[(1-methyl-4-piperidiny)carbonyl]pyrrolo[3,4-c]pyrazol-3-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色固体

溶解性：.....DMSO：72 mg/mL (199.18 mM)；Water Insoluble；Ethanol：72 mg/mL (199.18 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	PHA-793887 是一种新型有效的 CDK2，CDK5 和 CDK7 抑制剂，IC50 分别为 8 nM，5 nM 和 10 nM，作用于 CDK2，5，和 7 比作用于 CDK1，4，和 9 选择性高 6 倍以上。				
特性	PHA-793887 是新型有效的二代 CDK 抑制剂。				
靶点	CDK5/p25 (Cell-free assay)	CDK2/CyclinA (Cell-free assay)	CDK2/CyclinE (Cell-free assay)	CDK7/CyclinH (Cell-free assay)	CDK1/CyclinB (Cell-free assay)
	5 nM	8 nM	8 nM	10 nM	60 nM
体外研究	PHA-793887 抑制许多肿瘤细胞系增殖，包括 A2780, HCT-116, COLO-205, C-433, DU-145, A375, PC3, MCF-7, 和 BX-PC3, IC50 为 88nM-3.4 μM。PHA-793887 作用于白血病细胞系包括 K562, KU812, KCL22, 和 TOM1 时有细胞毒性, IC50 为 0.3-7 μM, 但是作用于正常未受刺激				

	处理的外周血单核细胞或 CD34+造血干细胞时没有细胞毒性。PHA-793887 作用于白血病细胞系具有高活性，IC50 < 0.1 μM。PHA-793887 诱导细胞周期停滞，抑制 Rb 和核磷蛋白磷酸化，0.2–1 μM 时调节 cyclin E 和 cdc6 表达，5 μM 时诱导凋亡。
体内研究	PHA-793887(10–30mg/kg)作用于人类卵巢癌 A2780,结肠癌 HCT-116,和胰腺癌 BX-PC3 移植瘤模型具有高效性。PHA-793887(20mg/kg)作用于携带 K562 和 HL60 细胞的移植瘤模型, 原代白血病扩散细胞模型,和复发 Philadelphia-阳性急性淋巴性白血病患者体内获得的高负担扩散性 ALL-2 模型具有高效性。

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)

MB4021	BMS-265246
MB4023	BS-181 HCl
MB4001	Dinaciclib (SCH727965)

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。PHA-793887 是一种有效的，ATP 竞争性的 CDK 抑制剂，可抑制 Cdk2, Cdk1, Cdk4 和 Cdk9 的活性。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	2.7664 mL	13.8320 mL	27.6640 mL
5 mM	0.5533 mL	2.7664 mL	5.5328 mL
10 mM	0.2766 mL	1.3832 mL	2.7664 mL
50 mM	0.0553 mL	0.2766 mL	0.5533 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>CDK 激酶实验: 在激酶 buffer 中加入 ATP/33Pγ-ATP 混合物,底物,和特定酶(0.7–100 nM), 最终体积为 30 μL, 然后加入 PHA-793887 (1.5 nM–10 μM)室温下反应 30 到 90 分钟。温育后, 反应停止, 使用 SPA, Dowex 树脂, 或 Multiscreen 磷酸纤维素滤膜, 从未渗透的放射性 ATP 中分离磷酸化底物, 方法如下: (1) SPA 实验。加入 100 μL PBS, 32 mM EDTA, 0.1% TritonX-100, 500 μM ATP,和 1 mg 链霉素包被的 SPA 片, 终止反应。温育 20 分钟, 获取底物后, 100 μL 反应混合物转移到包含 100 μL 5 MCsCl 的 Optiplate 96 孔板上, 竖立 4 小时使分层到板的另一端, 使用 TopCount 测量磷酸化底物。(2) Dowex 树脂实验。加入 150 μL 树脂/甲酸盐, pH 为 3.00, 终止反应, 获取未反应的 33Pγ-ATP, 在溶液从磷酸化底物中分离。60 分钟后, 50 μL 上清液转移到 Optiplate 96 孔板上。加入 150 μL Microscint40, 使用 TopCount 计算放射性。(3) Multiscreen 实验。加入 10 μL EDTA (150 mM), 终止反应。100 μL 转移到 MultiScreen 板上, 使底物结合到磷酸纤维素过滤器上。用 MultiScreen 过滤系统过滤的 100 μL H2PO4 (75 mM) 冲洗板, 冲洗三次。烘干, 加入 100 μL Microscint 0, 使用 TopCount 计算放射性。通过回归曲线分析 IC50 值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: A2780 细胞 Concentrations: 0.1 nM–1 μM, 溶于 DMSO. Incubation Time: 72 小时</p>

	<p>Method: 细胞接种在 96 或 384 孔板上, 每 cm² 浓度为 1×10⁴ 到 3×10⁴。24 小时后, 用连续稀释的 PHA-793887 处理细胞。处理 72 小时后, 通过 CellTiter-Glo 实验测定细胞数。使用 sygmoidal 设备测定 IC50 值。 (Only for Reference)</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带人类卵巢癌 A2780, 结肠癌 HCT-116 和胰脏癌 BX-PC3 细胞的鼠移植瘤模型 Formulation: 溶于 5% 葡萄糖溶液中 Dosages: 10, 20, 和 30 mg/kg Administration: 静脉注射, 每天一次。</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(M ²)	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。