

Barasertib; AZD1152-HQPA

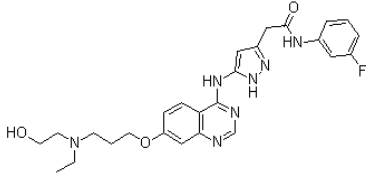
产品编号: MB4028

质量标准: >98%, Aurora B 抑制剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C26H30FN7O3	结 构 式	
分子量	507.56		
CAS No.	722544-51-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 102 mg/mL (200.96 mM)		
	Water: Insoluble		
	Ethanol : 3 mg/mL (5.91 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: AZD1152-HQPA 是一种高度选择性的 Aurora B 抑制剂, 对 Aurora B 的选择性是 Aurora A 的 3700 倍。

别名: 巴拉塞替; AZD2811; INH-34; AZD1152-HQPA; 1H-Pyrazole-3-acetamide, 5-[[7-[3-[ethyl(2-hydroxyethyl)amino]propoxy]-4-quinazoliny]amino]-N-(3-fluorophenyl)-

物理性状及指标:

外观:白色至黄色固体

溶解性:DMSO: 102 mg/mL (200.96 mM); Water: Insoluble; Ethanol : 3 mg/mL (5.91 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	AZD1152-HQPA (Barasertib)是高度选择性的 Aurora B 抑制剂, IC50 为 0.37 nM,作用于 Aurora B 比作用于 Aurora A 选择性高 100 倍左右。
靶点	Aurora B
IC50	0.37 nM
体外研究	AZD1152 作用于 Aurora B 比作用于 Aurora A 选择性高 3000 多倍, IC50 为 1.368 μM。AZD1152 作用于 50 种其他丝-苏氨酸和酪氨酸激酶, 包括 FLT3, JAK2, 和 Abl 活性更低。AZD1152 抑制造血恶性细胞增殖, 如 HL-60, NB4, MOLM13, PALL-1, PALL-2, MV4-11, EOL-1, THP-1, 和 K562 细胞, IC50 为 3-40 nM,效果比另一种 Aurora 激酶抑制剂 ZM334739 高 100 多倍, IC50 为 3-30 μM。AZD1152 抑制 MOLM13 和 MV4-11 细胞克隆生长, IC50 分别为 1 nM 和 2.8 nM,也抑制新分离的抗 Imatinib 的白血病细胞, IC50 为 1-3

	nM, 比作用于骨髓单核细胞更有效, IC50>10 nM。AZD1152 诱导携带 4N/8N DNA 的细胞累积, 随后凋亡, 这种作用存在剂量和时间依赖性。
体内研究	AZD1152 按 25 mg/kg 剂量单独处理 MOLM13 移植瘤, 显著抑制肿瘤生长, 平均肿瘤体积从 1261 mm ³ 降低到 71 mm ³ , 且平均肿瘤重量从 583 mg 降低到 78 mg, 观察到坏死组织被吞噬细胞浸润。此外, AZD1152 每天按 10-150 mg/kg 剂量处理多种人类实体移植瘤, 包括结肠癌, 乳腺癌, 和肺癌, 显著抑制肿瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性。

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)

MB4029	ZM 447439
MB4031	SNS-314 Mesylate
MB4027	Alisertib (MLN8237)

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。AZD1152-HQPA 是一种高度选择性的 Aurora B 抑制剂, 对 Aurora B 的选择性是 Aurora A 的 3700 倍。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		1.9702 mL	9.8511 mL	19.7021 mL
5 mM		0.3940 mL	1.9702 mL	3.9404 mL
10 mM		0.1970 mL	0.9851 mL	1.9702 mL
50 mM		0.0394 mL	0.1970 mL	0.3940 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>Cell lines: HL-60, NB4, MOLM13, PALL-2, MV4-11, EOL-1, 和 K562</p> <p>Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为~100 nM</p> <p>Incubation Time: 24 或 48 小时</p> <p>Method: 使用不同浓度 AZD1152 处理细胞 24 或 48 小时。通过测量 ³H-胸苷摄取 (在收集前 6 小时, 加入同位素) 而测量细胞增殖, 根据剂量-反应曲线计算 IC50 值。通过流式细胞仪分析细胞周期。通过膜联蛋白 V-FITC 凋亡检测试剂盒测量细胞凋亡。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 皮下注射 MOLM13 细胞的雌性免疫缺陷 BALB/c 裸鼠</p> <p>Formulation: 溶于 3M Tris, pH 9.0, 浓度为 2.5 mg/mL</p> <p>Dosages: 5 或 25 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射, 每周 4 次, 或每隔一天一次</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。