

## ZM 447439

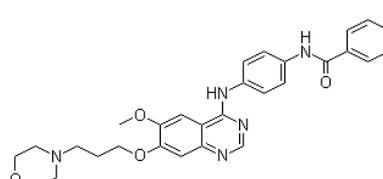
产品编号: MB4029

质量标准: >98%, Aurora A 和 Aurora B 抑制剂

包装规格: 5MG;25MG;50MG

产品形式: solid

### 基本信息

|           |                                 |             |  |
|-----------|---------------------------------|-------------|--|
| 分子式       | C29H31N5O4                      | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量       | 513.59                          |             |  |
| CAS No.   | 331771-20-1                     |             |  |
| 储存条件      | -20°C, 避光防潮密闭干燥                 |             |  |
| 溶解性(25°C) | DMSO: 103 mg/mL (200.54 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:** ZM-447439 是极光激酶 (aurora) 抑制剂, 作用于 aurora A 和 B .

**别名:** Benzamide, N-[4-[[6-methoxy-7-[3-(4-morpholinyl)propoxy]-4-quinazoliny]amino]phenyl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至灰色固体

溶解性: .....DMSO: 103 mg/mL (200.54 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

|             |  |                                  |                             |                             |                              |
|-------------|--|----------------------------------|-----------------------------|-----------------------------|------------------------------|
| <b>产品描述</b> | ZM 447439 是一种选择性的, ATP 竞争性 Aurora A 和 Aurora B 抑制剂, IC50 分别为 110 nM 和 130 nM, 作用于 Aurora A/B 比作用于 MEK1, Src, Lck 选择性高 8 倍, 对 CDK1/2/4, Plk1, Chk1 等几乎没有作用效果。                                     |                                  |                             |                             |                              |
| <b>特性</b>   | ZM-447439 是 Aurora 选择性 ATP 竞争性抑制剂  |                                  |                             |                             |                              |
| <b>靶点</b>   | Aurora A<br>(Cell-free<br>assay)   | Aurora B<br>(Cell-free<br>assay) | LCK<br>(Cell-free<br>assay) | Src<br>(Cell-free<br>assay) | MEK1<br>(Cell-free<br>assay) |
|             | 110 nM   | 130 nM                           | 880 nM                      | 1.03 μM                     | 1.79 μM                      |
| <b>体外研究</b> | 体外, ZM-447439 选择性抑制重组人类 Aurora A 和 B, IC50 分别为 110 和 130 nM, 而抑制其他不同结构类型蛋白激酶, 包括有丝分裂激酶 CDK1 和 PLK1 时, IC50 > 10 μM. Aurora 激酶抑制剂, ZM-447439 抑制 BON, QGP-1 和 MIP-101 三种细胞系生长, 连续处理 72 小时, IC50 分别 |                                  |                             |                             |                              |

|  |
|--|
| 为 3 $\mu$ M , 0.9 $\mu$ M 和 3 $\mu$ M , 这种作用存在时间和剂量依赖性。此外, ZM-447439 通过促进 DNA 分裂和 caspase 3 和 7 激活,有效诱导细胞凋亡, 且使 GEP-NET 细胞在 G0/G1 期和 G2/M 期停顿。在小鼠胚胎中, ZM-447439 抑制 Aurora 激酶,通过在每个胚胎周期使用不同干扰, 调节 G2 到中期的组蛋白 H3 serine 10 (H3S10Ph)而使前两次分裂发生异常。最新研究显示 ZM-447439 作用于宫颈癌 SiHa 细胞, 抑制生长和凋亡, 且增强对 Cisplatin 的化学敏感性。 |
|--|

**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。ZM 447439 是一种选择性的, ATP 竞争性 Aurora A 和 Aurora B 抑制剂,本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

| 体 积<br>浓度 | 质 量 | 1 mg      | 5 mg      | 10 mg      |
|-----------|-----|-----------|-----------|------------|
| 1 mM      |     | 1.9471 mL | 9.7354 mL | 19.4708 mL |
| 5 mM      |     | 0.3894 mL | 1.9471 mL | 3.8942 mL  |
| 10 mM     |     | 0.1947 mL | 0.9735 mL | 1.9471 mL  |
| 50 mM     |     | 0.0389 mL | 0.1947 mL | 0.3894 mL  |

**经典实验操作 (仅供参考)**

|             |  |
|-------------|--|
| <b>激酶实验</b> | <p><b>体外激酶实验:</b><br/>使用杆状病毒表达体系, 表达重组 Aurora A 和 B 作为氨基末端 His<sub>6</sub> 标记融合蛋白。使用 Ni-NTA 琼脂糖, 通过亲和层析纯化 Aurora A, 使用 CM Sepharose Fast Flow, 通过离子交换层析纯化 Aurora B。1 ng 纯化的重组酶加到反应中, 反应中含 25 mM Tris-HCl, pH 7.5, 12.5 mM KCl, 2.5 mM NaF, 0.6 mM DTT, 6.25 mM MnCl<sub>2</sub>, 10 <math>\mu</math>M 肽底物, 10 <math>\mu</math>M ATP (Aurora A), 5 <math>\mu</math>M ATP (Aurora B), 和 0.2 <math>\mu</math>Ci <math>\gamma</math>[<sup>33</sup>P]ATP (比活<math>\geq</math>2,500 Ci/mmol), 然后在室温下温育 60 分钟。加入 20% 磷酸反应终止, 使用 P30 硝化纤维过滤器获得产物, 使用 Beta 板™ 计数器测定 <sup>33</sup>P 摄入率。</p> |
| <b>细胞实验</b> | <p><b>Cell lines:</b> BON, QGP-1 和 MIP-101<br/><b>Concentrations:</b> 0 到 5 <math>\mu</math>M<br/><b>Incubation Time:</b> 72 小时<br/><b>Method:</b> 通过结晶紫染色测评细胞数。细胞接种在 96 孔板上, 与 1% 戊二醇混合。细胞用 0.1% 结晶紫染色。用水冲洗未结合的染料。用 0.2% Triton X-100 溶解结合的结晶紫。使用 ELISA 读数器在 570 nm 处分析线性增加的细胞数。</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(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。