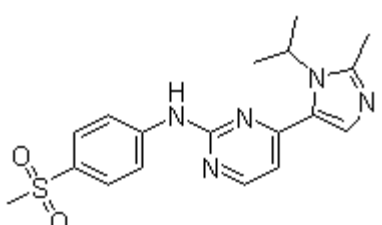


## AZD5438

产品编号: MB4041  
质量标准: >98%, CDK1/2/9 抑制剂  
包装规格: 10MG;50MG;200MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C18H21N5O2S	结 构 式	
分子量	371.46		
CAS No.	602306-29-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 74 mg/mL (199.21 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 74 mg/mL (199.21 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:** AZD-5438 是一种有效的 CDK1/2/9 抑制剂, 同时抑制 GSK3β, 对 CDK5/6 的作用较弱。

**别名:** 2-Pyrimidinamine,

4-[2-methyl-1-(1-methylethyl)-1H-imidazol-5-yl]-N-[4-(methylsulfonyl)phenyl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO: 74 mg/mL (199.21 mM); Water Insoluble; Ethanol: 74 mg/mL (199.21 mM)

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>	AZD5438 是一种有效的 CDK1/2/9 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 16 nM/6 nM/20 nM。对 CDK5/6 作用效果稍弱, 对 GSK3β 也有抑制作用。		
<b>特性</b>	一种周期蛋白依赖性激酶(CDK) 1, 2, 和 9 的有效抑制剂。		
<b>靶点</b>	CDK2 (Cell-free assay)	CDK1 (Cell-free assay)	CDK9 (Cell-free assay)
	6 nM	16 nM	20 nM
<b>体外研究</b>	AZD5438 对细胞周期素依赖性激酶, 包括细胞周期素 E-cdk2, 细胞周期素 A-cdk2, 细胞周期素 B1-cdk1, 细胞周期素 D3-cdk6, 和细胞周期素 T-cdk9 的活性表现出有效的抑制作用, IC50 分别为 6 nM, 45 nM, 16 nM, 21 nM, 和 20 nM。此外, AZD5438 也会抑制 p25-cdk5 和糖原		

	合成激酶 3β 的激酶活性, IC50 分别为 14 nM 和 17 nM。AZD5438 通过抑制 cdk-依赖性底物的磷酸化作用诱导细胞周期阻滞, 并对一系列肿瘤细胞系, 包括肺, 结肠直肠, 乳腺, 前列腺, 和血液肿瘤表现出广泛的抗增殖活性, IC50 范围为 0.2 μM (MCF-7) 到 1.7 μM (ARH-77)。
<b>体内研究</b>	在体内, AZD5438 口服治疗对衍生自各种不同类型的癌症, 包括乳腺癌, 结肠癌, 肺癌, 前列腺癌和卵巢癌的人体肿瘤异种移植物的生长产生统计学显著的抑制作用, 最大 TGI 范围为 38% 到 153%。在 SW620 异种移植模型中, AZD5438 会对各种细胞周期蛋白, 比如 pHH3, 磷酸核仁素, PP1a, 和几种磷酸- pRb 多肽产生剂量依赖性抑制作用。

**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	<a href="#">BMS-265246</a>
MB4023	<a href="#">BS-181 HCl</a>
MB4001	<a href="#">Dinaciclib (SCH727965)</a>

**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。AZD-5438 是一种有效的 CDK1/2/9 抑制剂, 同时抑制 GSK3β, 对 CDK5/6 的作用较弱。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		2.6921 mL	13.4604 mL	26.9208 mL
5 mM		0.5384 mL	2.6921 mL	5.3842 mL
10 mM		0.2692 mL	1.3460 mL	2.6921 mL
50 mM		0.0538 mL	0.2692 mL	0.5384 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p>重组激酶试验: AZD5438 抑制 cdk 活性的能力通过闪烁逼近分析法检测, 使用重组 cdk-细胞周期素复合物细胞周期素-Ecdk2, cdk2-细胞周期素 A, cdk4-细胞周期素 D, 和重组视网膜母细胞瘤底物(氨基酸 792-928)或 cdk1-细胞周期素 B1, 以及衍生自体外组蛋白 H1(biotin-X-Pro-Lys-Thr-Pro-Lys-Lys-Ala-Lys-Lys-Leu)p34cdc2 磷酸化位点的多肽底物进行。AZD5438 对重组 cdk5/p25 (2 μM ATP)的活性基于闪烁逼近分析法试验使用多肽底物 (AKKPKTPKKAKKLOH)进行测定。糖原合成酶激酶 3β 活性的抑制通过闪烁逼近分析法使用纯化的人糖原合成酶激酶 3β 酶和真核起始因子 2B 底物(1 μM ATP)进行测定。AZD5438 对活性重组人 cdk6-细胞周期素 D3, cdk7-细胞周期 H/MAT1 (cdk 活化激酶复合物), 和 cdk9-cyclin T 的作用使用激酶选择性筛选技术进行筛选。</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: MCF-7, HCT-116, A549, 和 IM-9 Concentrations: 0 到 10 μM Incubation Time: 48 小时或 72 小时 Method: 测试 AZD5438 对实体肿瘤细胞系的作用。简而言之, 细胞与一系列浓度的 AZD5438 培养 48 小时。在培养结束时, 细胞用 5-溴-2'-脱氧尿苷 (BrdUrd)脉冲, 测量 DNA 合成的量。抑</p>

	制增殖的 IC50 独立于细胞死亡特异性测定。多重骨髓瘤细胞系接种到 96 孔板的 RPMI 1640 中，用 10% FCS 和谷氨酸盐进行增补，并给药 AZD5438，培养 72 小时。细胞生长使用 AlamarBlue 测量，GI50 值根据预处理对照值进行计算。
<b>动物实验</b>	Animal Models: 皮下注射 MCF-7, HCT-116, A549, 和 IM-9 细胞的 Swiss 无毛小鼠和无毛大鼠。 Formulation: AZD5438 在羟丙基甲基纤维素中溶解。 Dosages: ≤100 mg/kg Administration: 口服给药

**【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。