

## JNJ-7706621

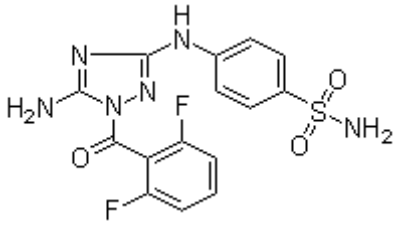
产品编号: MB4043

质量标准: >98%, pan-CDK 抑制剂

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C15H12F2N6O3S	结 构 式	
分子量	394.36		
CAS No.	443797-96-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 79 mg/mL (200.32 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:** JNJ-7706621 是一种有效的 aurora kinase 抑制剂, 同时也能有效抑制 CDK1 和 CDK2。

**别名:** Benzenesulfonamide, 4-[[5-amino-1-(2,6-difluorobenzoyl)-1H-1,2,4-triazol-3-yl]amino]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO: 79 mg/mL (200.32 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>	JNJ-7706621 是 pan-CDK 抑制剂, 最有效作用于 CDK1/2, IC50 为 9 nM/4 nM, 作用于 CDK1/2 比作用于 CDK3/4/6 选择性高 6 倍以上。也有效抑制 Aurora A/B, 对 Plk1 和 Wee1 没有抑制活性。				
<b>靶点</b>	CDK1/Cyclin B	CDK2/Cyclin A	CDK2/Cyclin E	Aurora-A	Aurora-B
<b>IC50</b>	9 nM	4 nM	3 nM	11 nM	15 nM
<b>体外研究</b>	JNJ-7706621 作用于 CDK1 和 2 具有高度有效性, IC50 为 3-9 nM。JNJ-7706621 也抑制 CDK3, 4, 和 6, IC50 为 58-253 nM。JNJ-7706621 抑制 Aurora-A 和 B, IC50 分别为 11 和 15 nM。JNJ-7706621 也抑制 VEGF-R2, FGF-R2, 和 GSK3β, IC50 为 154-254 nM。JNJ-7706621 抑制一组人类癌细胞, 包括 HeLa, HCT-116, SK-OV-3, PC3, DU145, A375, MDA-MB-231, MES-SA, 和 MES-SA/Dx5, IC50 为 112-514 nM。JNJ-7706621 抑制正常细胞系, 包括 MRC-5, HASMC, HUVEC, 和 HMVEC 生长的效果低好几倍, IC50 为 3.67-5.42 μM。0.5-3 μM JNJ-7706621 作用于 HeLa 或 U937 细胞, 使细胞停滞在 G2-M 期, 诱导核内复制, 激活凋亡, 且降低集落形成。				

<b>体内研究</b>	100 或 125 mg/kg JNJ-7706621 处理携带 A375 恶性黑色素瘤人类肿瘤移植瘤模型的小鼠, 导致肿瘤衰退。
<b>特征</b>	JNJ-7706621 是新型有效的广谱 CDK 和 Aurora 激酶抑制剂。

**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)**

MB4044	AT7519
MB7103	AT7519.HCl
MB4041	AZD5438

**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。JNJ-7706621 是一种多靶点抑制剂, 作用于 aurora kinase, CDK1 和 CDK2。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	2.5358 mL	12.6788 mL	25.3575 mL
5 mM	0.5072 mL	2.5358 mL	5.0715 mL
10 mM	0.2536 mL	1.2679 mL	2.5358 mL
50 mM	0.0507 mL	0.2536 mL	0.5072 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>体外 CDK1 和 Aurora 激酶实验:</b></p> <p>测定 CDK1 激酶活性, 使用从杆状病毒纯化的 CDK1/cyclin B 复合体, 使含组蛋白 H1 磷酸化位点的生物素化肽底物磷酸化。在链霉亲和素包被的 96 孔闪烁板上, 通过观察 <sup>33</sup>P-γ-ATP 渗透进固定底物的降低量, 测定 CDK1 抑制活性。在 50 mM Tris-HCl (pH 8), 10 mM MgCl<sub>2</sub>, 0.1 mM Na<sub>3</sub>VO<sub>4</sub>, 1 mM DTT, 1% DMSO, 0.25 μM 肽, 每孔 0.1 μCi <sup>33</sup>P-γ-ATP, 和 5 μM ATP 混合物中稀释 CDK1 酶, 然后在 30°C 下温育 1 小时。用含 100 mM EDTA 的 PBS 冲洗, 终止反应, 使用闪烁计数器计数。线性回归分析 JNJ-7706621 的抑制百分数, 测定 IC<sub>50</sub> 值。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> HeLa, HCT-116, A375, SK-OV-3, MDA-MB-231, 和 PC-3 细胞</p> <p><b>Concentrations:</b> 1 nM-10 μM, 溶于 DMSO</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 通过测定 <sup>14</sup>C 标记的胸苷渗透进细胞内新合成 DNA 的量而测定 JNJ-7706621 抑制细胞增殖的能力。细胞胰蛋白酶化, 计数, 然后每孔 3-8×10<sup>3</sup> 个细胞加到 96 孔 CytoStar 组织培养闪烁板上, 板上含 100 μL 完全培养基。细胞在完全培养基上 37°C 下温育 24 小时。然后, 每孔加入 1 μL JNJ-7706621。细胞再次温育 24 小时。甲基 <sup>14</sup>C 胸苷 56 mCi/mmol 在完全培养基中稀释, 然后加入到 CytoStar 板中, 每孔加 0.2 μCi。JNJ-7706621 和 <sup>14</sup>C 胸苷在板中 37°C 下温育 24 小时。移除板上的混合物, 然后用 200 μL PBS 冲洗板冲洗 2 次。每孔加入 200 μL PBS, 用透明板密封装置在板顶端进行密封, 用白色板衬垫密封板的底端。在 Packard Top 计数器上测定甲基 <sup>14</sup>C 胸苷渗透程度。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 携带 A375 细胞移植瘤模型的小鼠</p>

	<p><b>Formulation:</b> 溶于含溶于无菌水的 0.1% Tween-80 的 0.5% 甲基纤维素</p> <p><b>Dosages:</b> 100 或 125 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理或腹腔注射</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。