

## CX6258 HCl ; CX-6258 HCL

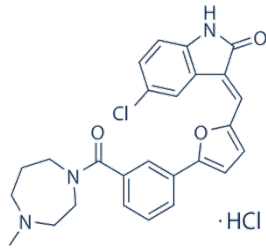
产品编号 : MB4587

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C <sub>26</sub> H <sub>24</sub> ClN <sub>3</sub> O <sub>3</sub> .HCl	结 构 式	
分子量	498.40		
CAS No.	1353859-00-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 57 mg/mL warmed (114.36 mM)		
	Water : 89 mg/mL warmed (178.57 mM)		
	Ethanol : 1 mg/mL warmed (2.0 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 :** CX-6258 HCl 是强效的可口服的 pan-Pim kinase 抑制剂。

### 别名 :

(3E)-5-chloro-3-[[5-[3-[(hexahydro-4-methyl-1H-1,4-diazepin-1-yl)carbonyl]phenyl]-2-furanyl]methylene]-1,3-dihydro-2H-Indol-2-one, hydrochloride (1:1)

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色粉末

溶解性 : .....DMSO : 57 mg/mL warmed (114.36 mM) ; Water : 89 mg/mL warmed (178.57 mM) ; Ethanol : 1 mg/mL warmed (2.0 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>	CX-6258 HCl 是强效的可口服的 pan-Pim kinase 抑制剂，其对 Pim1, Pim2, 和 Pim3 的 IC50 分别为 5 nM, 25 nM 和 16 nM。		
<b>靶点</b>	Pim1(Cell-free assay) 5 nM	Pim3(Cell-free assay) 16 nM	Pim2(Cell-free assay) 25 nM
<b>体外研究</b>	CX-6258 对一组人癌细胞系显示出抗增殖活性，IC50 为 0.02-3.7 μM，对急性白血病细胞系最敏感。CX-6258 与阿霉素(10:1 摩尔比)结合，和 CX-6258 与紫杉醇(100:1 摩尔比)结合产生协同细胞杀伤力，复合指数(CI50)值分别为 0.4 和 0.56。CX-6258 剂量依赖性抑制两种促存活蛋白，Bad 和 4E-BP1 的磷酸化作用，分别在 Pim 激酶特定位点 S112 和 S65 和 T37/46。		
<b>体内研究</b>	CX-6258 表现出剂量依赖性功效，抑制 MV-4-11 异种移植的小鼠体内肿瘤的生长，50 毫克/千克剂量产生 45% 肿瘤生长抑制(TGI)，100 毫克/千克剂量产生 75% TGI		

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)

MB6975	AZD1208
MB4062	SMI-4a
MB5142	SGI-1776

**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。CX-6258 HCl 是强效的可口服的 pan-Pim kinase 抑制剂本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 浓	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.0064 mL	10.0321 mL	20.0642 mL
5 mM	0.4013 mL	2.0064 mL	4.0128 mL
10 mM	0.2006 mL	1.0032 mL	2.0064 mL
50 mM	0.0401 mL	0.2006 mL	0.4013 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验</b>	<p><b>Pim 活性试验:</b></p> <p>Pim-1 和 Pim-2 的抑制作用在放射性试验中通过人重组 Pim-1 [ATP] = 30 μM (基底 RSRHSSYPAGT)和人重组 Pim-2 [ATP] = 5 μM (基底 RSRHSSYPAGT)测定。Pim-3 的放射性试验在[ATP] = 155 μM 存在下使用 RSRHSSYPAGT 作为基底。</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。