

OSU-03012(AR-12) ; OSU03012

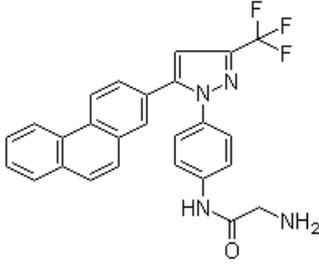
产品编号 : MB6916

质量标准 : >98%,有效的重组 PDK-1 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

| | | | |
|---------------|--|-------------|---|
| 分子式 | C26H19F3N4O | 结 构 式 |  |
| 分子量 | 460.45 | | |
| CAS No. | 742112-33-0 | | |
| 储存条件 | -20°C, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO 11 mg/mL (23.88 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 : OSU-03012 是一种 PDK-1 抑制剂。

别名 : AR-12 ; Acetamide, 2-amino-N-[4-[5-(2-phenanthrenyl)-3-(trifluoromethyl)-1H-pyrazol-1-yl]phenyl]-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO 11 mg/mL (23.88 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

| | |
|-------------|---|
| 产品描述 | OSU-03012 (AR-12)是一种有效的重组 PDK-1(phosphoinositide-dependent kinase 1)抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为 5 μM, 比 OSU-02067 作用效果高 2 倍。 |
| 特性 | OSU-03012 是 celecoxib 衍生物, 比 celecoxib 的抗癌活性高,但是不能抑制 COX2。 |
| 靶点 | PDK-1 (Cell-free assay) |

| | |
|-------------|---|
| | 5 μ M |
| 体外研究 | <p>OSU-03012 诱导 PC-3 细胞凋亡, IC₅₀ 为 5 μM, 且降低免疫沉淀的 p70S6K 的活性。Celecoxib 完全抑制肿瘤细胞生长, 浓度至少需要 50 μM, 而 OSU-03012 浓度为 3-5 μM 时即可完全抑制多种肿瘤细胞生长。与作用于正常的胶质细胞相比, OSU-03012 作用于神经胶质瘤细胞更有效促进细胞死亡。OSU-03012 和电离辐射使 caspase 非依赖性的细胞死亡增多。</p> <p>OSU-03012 促进组织蛋白酶 B 从溶酶体中释放, 及 AIF 从线粒体中释放。在蛋白激酶 R 类的内质网激酶-/-细胞中, OSU-03012 的药效减弱, 和 BID 的分裂下降有关, 且阻断组织蛋白酶 B 和 AIF 释放到细胞质中。OSU-03012 抑制甲状腺癌细胞(NPA, WRO, 和 ARO 细胞) 增殖和迁移, 且诱导凋亡, 结果导致 S 期细胞增多, G₂ 期细胞没有增多。OSU-03012 为 ATP 竞争性抑制剂, 作用于甲状腺癌细胞, 抑制 PAK 活性和 AKT 磷酸化。OSU-03012 抑制肝细胞癌细胞系包括 Huh7, Hep3B 和 HepG2 细胞生长, IC₅₀<1 μM。OSU-03012 作用于 Huh7 细胞, 不抑制 PDK1 或 AKT 活性, 也不诱导细胞凋亡, 但是诱导自噬。而且, 用 OSU-03012 处理后, 引起活性氧(ROS)积累。最新研究显示 OSU-03012 可增强(Bcr)-Abl 突变细胞系对 imatinib 诱导的凋亡的敏感性。</p> |
| 体内研究 | <p>OSU-03012 按 200 mg/kg 剂量作用于 Huh7 移植瘤, 抑制 57.59%的肿瘤生长。[4] OSU-03012 作用于 MDA-MB-435/LCC6 移植瘤。明显降低 EGFR 蛋白表达, 下降约 48%, 也阻止 YB-1 结合到 EGFR 启动子上。[6] 口服处理 OSU-03012, 抑制 HMS-97 神经鞘移植瘤的生长达 55%。</p> |

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)

| | |
|--------|------------|
| MB3974 | BX-795 |
| MB3973 | BX-912 |
| MB3972 | GSK2334470 |
| MB1370 | PS48 |

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。本品 OSU-03012 是一种 PDK-1 抑制剂, 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 | 2.1718 mL | 10.8589 mL | 21.7179 mL |
| 5 mM | 0.4344 mL | 2.1718 mL | 4.3436 mL |
| 10 mM | 0.2172 mL | 1.0859 mL | 2.1718 mL |
| 50 mM | - | - | - |

经典实验操作（仅供参考）

| | |
|--------------------|--|
| <p>激酶实验</p> | <p>PDK-1 激酶实验: 根据重组 PDK-1 的活力进行无细胞实验,对照组用 DMSO , 实验组 用 OSU-03012,激活 PDK-1 的下游激酶血清和糖皮质激素调节的激酶, 反之, 用 $[\gamma\text{-}^{32}\text{P}]\text{ATP}$ 使 Akt/血清和糖皮质激素调节的激酶特定肽底物 RPRAATF 磷酸化。使用 P81 磷酸纤维素纸, 使 ^{32}P-磷酸化的肽底物从残余的 $[\gamma\text{-}^{32}\text{P}]\text{-ATP}$ 中分离, 用 0.75%磷酸冲洗三次后, 用闪烁计数器计数。</p> |
| <p>细胞实验</p> | <p>Cell lines: PC-3 细胞 Concentrations: 0-10 μM Incubation Time: 约为 72 小时 Method: 使用 MTT 实验测定 OSU-03012 作用于 PC-3 细胞活力的效果, 做 6 次平行实验。细胞生长在含 10% FBS 的 RPMI 1640 培养基中, 在 96 孔板中培养 24 小时, 然后在含 1% 血清 RPMI 1640 培养基中用溶于 DMSO (终浓度 $\leq 0.1\%$) 中的不同浓度 OSU-03012 (0-10 μM) 在不同时间间隔 (~72 小时) 处理。对照组用 DMSO 处理。移除培养基, 在 10% 含 FBS 的 RPMI 1640 培养基中加入 200 μL 0.5 mg/mL MTT, 然后在含 CO_2 的环境中 37°C 下温育 2 小时。移除上清液, 减少的 MTT 染料溶解在 200 μL DMSO 中。用计数板在 570nm 处测定吸光值。</p> |
| <p>动物实验</p> | <p>Animal Models: 携带 Huh7 移植瘤的雄性 BALB/c 裸鼠 Formulation: 溶解在 0.5% 甲基纤维素, 0.1% Tween-80 Dosages: 100-200mg/kg. Administration: 每天饲喂处理</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。

