

产品名称: **XL413**
产品别名: **XL413 (BMS-863233)**

生物活性:

Description	XL413 (BMS-863233) 是强效的选择性的 cell division cycle 7 homolog (CDC7) kinase 抑制剂, IC50 为 3.4 nM,其选择性分别超过 CK2, Pim-1 和 pMCM2 选择性的 63-, 12-和 35-倍。 Phase 1/2。				
IC ₅₀ & Target	Cdc7 [1] (Cell-free assay)	Pim1 [1] (Cell-free assay)	CK2 [1] (Cell-free assay)		
	3.4 nM	42 nM	212 nM		
In Vitro	在 MDA-MB-231T 和 Colo-205 细胞系中, XL413 抑制 MCM2 的 CDC7 特异磷酸化作用。XL413 也会抑制 Colo-205 细胞中的细胞增殖, 降低细胞活性, 并激发胱天蛋白酶 3/7 的活性。此外, XL413 导致 S 期进展被改变, 随后引起细胞凋亡。[1]				
In Vivo	在 Colo-205 异种移植瘤模型中, XL413, 在 3 毫克/千克剂量下, 抑制 70%磷酸化的 MCM2, 并且在 100 毫克/千克剂量下引起显著的肿瘤生长退化。[1]				
Solvent&Solubility	In Vitro: Water (warmed with 50°C water bath): 46 mg/mL (141.03 mM) DMSO : Insoluble Ethanol: Insoluble				
	Preparing Stock Solutions	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.0658 mL	15.3290 mL	30.6579 mL
		5 mM	0.6132 mL	3.0658 mL	6.1316 mL
		10 mM	0.3066 mL	1.5329 mL	3.0658 mL
		50 mM	0.0613 mL	0.3066 mL	0.6132 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限 -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
References	[1] Koltun ES, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2012, 22(11), 3727-3731.				

实验参考:

Cell Assay	<p>细胞实验: [1]</p> <p>Cell lines: Colo-205 细胞</p> <p>Concentrations: ~10 μM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method:</p> <p>细胞增殖通过 BrdU 整合试验测定, 细胞活性通过细胞 Titer-Glo 试剂盒测定。</p>
Animal Administration	<p>动物实验: [1]</p> <p>Animal Models: 负荷 Colo-205 异种植物的小鼠</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: ~100 毫克/千克</p> <p>Administration: 口服</p>
	CDC7 激酶试验 : [1]

Kinase Assay	<p>激酶活性和化合物的抑制使用荧光素酶-荧光素-偶联化学荧光法测定，并根据 384 孔格式中的激酶反应利用的 ATP 百分比测量。最终 CDC7 激酶试验测定条件为 6 nM CDC7/ASK，1 μM ATP，50 mM Hepes pH 7.4，10 mM MgCl₂，0.02% BSA，0.02% brij 35，0.02% tween 20 和 1 mM DTT。值得注意的是，CDC7/ASK 蛋白质表现出与底物无关的 ATP 利用率。所有激酶反应在室温下培育 1-2 小时。</p>
References	<p>[1] Koltun ES, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2012, 22(11), 3727-3731.</p>



源叶生物