

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。				
IC₅₀ & 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				
		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	3.0658 mL	15.3290 mL	30.6579 mL
	Stock Solutions	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	细胞实验: [1] Cell lines: Colo-205 细胞 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 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。				
Animal Administration	动物实验: [1] Animal Models: 负荷 Colo-205 异种植物的小鼠 Formulation: -- Dosages: ~100 毫克/千克 Administration: 口服				
	CDC7 激酶试验 : [1]				

Kinase Assay	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 μ M ATP，50 mM Hepes pH 7.4，10 mM MgCl ₂ ，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。
References	[1] Koltun ES, et al. <i>Bioorg Med Chem Lett</i> . 2012, 22(11), 3727-3731.



源叶生物