



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **BAY-1143572**

产品别名: **Atuveciclib Racemate; BAY-1143572 Racemate**

生物活性:					
Description	Atuveciclib (BAY-1143572)是一种有效的、高选择性 PTEFb/CDK9 抑制剂,对 CDK9/CycT 的 IC50 值为 13 nM。它对 CDK2 的 IC50 是其对 CDK9 的约 100 倍。除了 CDK 家族成员,它还抑制 GSK3 激酶,对 GSK3 α 和 GSK3 β 的 IC50 值分别为 45 nM 和 87 nM。				
IC₅₀ & Target	CDK9 ^[1] (Cell-free assay)	GSK-3 α ^[1] ()	GSK3 β ^[1] ()		
	13 nM	45 nM	87 nM		
In Vitro	BAY 1143572 是一种有效的、高度选择性的 CDK9 抑制剂,对 CDK9/CycT1 的 IC50 值为 13 nM,对 CDK2 的 IC50 值是其 100 倍。除了 CDK 家族成员,在低于 1 μ M 浓度时,BAY 1143572 仅对 GSK3 激酶有抑制活性,对 GSK3 α 和 GSK3 β 的 IC50 值分别为 45 nM 和 87 nM。BAY 1143572 对 HeLa 细胞和 MOLM-13 细胞具有抗增殖活性,IC50 分别为 920 nM 和 310 nM。相对于 BAY-958, BAY 1143572 的 Caco-2 渗透率更高,而流出比率降低 ^[1] 。				
In Vivo	在大鼠体内进行药代动力学研究发现, BAY 1143572 的血浆清除率低(CL_b 1.1 L/h/kg),分布容积 (V_{ss}) 为 1.0 L/kg。其口服生物利用度为 54%,血液-血浆浓度比为 1。BAY 1143572 对细胞色素 P450 活性没有显著的抑制作用,IC50>20 μ M ^[1] 。在免疫不全的 NOD/Shi-scid/IL-2Ry ^{tm1} (NOG)小鼠中移植来自患者的 ATL 细胞, BAY 1143572 可大幅度减少 ATL 细胞渗透到器官中,如肝脏和骨髓; BAY 1143572 还降低血清中人源可溶性 IL2R 水平、减少 ATL 肿瘤负荷 ^[2] 。				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO :77 mg/mL (198.75 mM) Water: Insoluble Ethanol: Insoluble				
		Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	2.5811 mL	12.9056 mL	25.8111 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.5162 mL	2.5811 mL	5.1622 mL
		10 mM	0.2581 mL	1.2906 mL	2.5811 mL
	50 mM	0.0516 mL	0.2581 mL	0.5162 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] Lücking U, et al. ChemMedChem. 2017, 12(21):1776-1793. [2] Wong RWJ, et al. Molecules. 2018, 23(5). pii: E1057.				