



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto: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 $\alpha$ 和 GSK3 $\beta$ 的 IC50 值分别为 45 nM 和 87 nM。				
IC <sub>50</sub> & Target	CDK9 <sup>[1]</sup> (Cell-free assay)	GSK-3 $\alpha$ <sup>[1]</sup> ( )	GSK3 $\beta$ <sup>[1]</sup> ( )		
	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 $\mu$ M 浓度时,BAY 1143572 仅对 GSK3 激酶有抑制活性,对 GSK3 $\alpha$ 和 GSK3 $\beta$ 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 <sup>[1]</sup> 。				
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 <sub>b</sub> 1.1 L/h/kg),分布容积 (Vss) 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 $\mu$ M <sup>[1]</sup> 。在免疫不全的 NOD/Shi-scid/IL-2Ry <sup>null</sup> (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 <sup>[2]</sup> 。				
Solvent&Solubility	<b>In Vitro:</b> <b>DMSO :77 mg/mL (198.75 mM)</b> <b>Water: Insoluble</b> <b>Ethanol: Insoluble</b>				
		<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	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
<b>*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。</b>  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.				