

AT7519

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53273ES08	5 mg
AT7519	53273ES10	10 mg
	53273ES25	25 mg

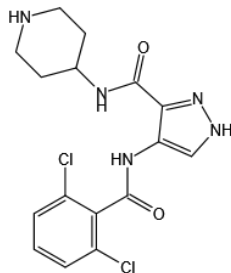
产品描述

AT7519 (AT 7519)是一种有效的 CDK 小分子抑制剂，作用于 CDK1/2/4/5/6/9 的 IC₅₀ 值分别为 210、47、100、13、170 和 <10 nM，通过调节细胞周期抑制多种癌症细胞增殖，表现出潜在的抗肿瘤活性。AT7519 对 CDK3 和 7 及其他非 CDK 激酶无抑制活性。AT7519 以 ATP 竞争性方式抑制 CDK1，K_i 值为 38 nM。此外，AT7519 也可抑制 GSK3β，IC₅₀ 值为 89 nM。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AT7519, AT 7519
靶点 (Target)	CDK1, CDK2, CDK4, CDK5, CDK6, CDK9, GSK-3β
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage--CDK
CAS 号 (CAS NO.)	844442-38-2
分子式 (Formula)	C ₁₆ H ₁₇ Cl ₂ N ₅ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	382.24
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20℃，有效期 3 年。建议分装后-20℃干燥保存，避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

AT7519 (0-4 μM)以时间依赖性方式诱导多发性骨髓瘤细胞凋亡， IC_{50} 为0.5-2 μM 。AT7519 (0.5 μM)抑制RNA聚合酶II CTD的磷酸化，并部分抑制MM.1S细胞中的RNA合成。^[1] AT7519 (100-700 nM)诱导白血病细胞系中的细胞凋亡，抑制RNA聚合酶II并降低抗凋亡蛋白水平。^[2] AT7519 (250 nM)抑制人肿瘤细胞系中的细胞周期，还诱导人肿瘤细胞系的凋亡。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

在人MM异种移植小鼠模型中，给药AT7519 (15 mg/kg)抑制肿瘤生长。^[1] AT7519按9.1 mg/kg剂量作用于HCT116和HT29结肠癌移植瘤模型，每天两次，引起早期和晚期肿瘤衰退。^[3]

参考文献

- [1]. Santo L, et al. AT7519, A novel small molecule multi-cyclin-dependent kinase inhibitor, induces apoptosis in multiple myeloma via GSK-3 β activation and RNA polymerase II inhibition. *Oncogene*. 2010 Apr 22;29(16):2325-36.
- [2]. Squires MS, et al. AT7519, a cyclin-dependent kinase inhibitor, exerts its effects by transcriptional inhibition in leukemia cell lines and patient samples. *Mol Cancer Ther*. 2010 Apr;9(4):920-8.
- [3]. Squires MS, et al. Biological characterization of AT7519, a small-molecule inhibitor of cyclin-dependent kinases, in human tumor cell lines. *Mol Cancer Ther*. 2009 Feb;8(2):324-32.