

AZD5363 (Capivasertib)

产品信息

| 产品名称 | 产品编号 | 规格 |
|------------------------|-----------|-------|
| AZD5363 (Capivasertib) | 53378ES08 | 5 mg |
| | 53378ES25 | 25 mg |

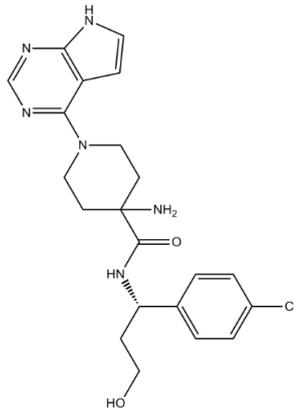
产品描述

AZD5363 (Capivasertib)是一种高效的 Akt 抑制剂,可以抑制 Akt 的所有亚型,其对 Akt1、Akt2、Akt3 的 IC₅₀ 值为 3 nM、8 nM、8 nM,对 P70S6K/PKA 也具有相似的抑制作用,但对 ROCK1/2 抑制作用较弱。AZD5363 还可诱导细胞凋亡。

产品性质

| | |
|------------------------|---|
| 英文别名 (English Synonym) | Capivasertib |
| 中文名称 (Chinese Name) | AKT 抑制剂 |
| 靶点 (Target) | Akt1; Ak2; Akt3; ROCK2 |
| 通路 (Pathway) | PI3K/Akt/mTOR--Akt |
| CAS 号 (CAS NO.) | 1143532-39-1 |
| 分子式 (Formula) | C ₂₁ H ₂₅ ClN ₆ O ₂ |
| 分子量 (Molecular Weight) | 428.92 |
| 外观 (Appearance) | 粉末 |
| 纯度 (Purity) | ≥98% |
| 溶解性 (Solubility) | 溶于 DMSO, 不溶于水 |

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C,有效期3年。建议分装后-20°C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）

AZD5363 抑制 AKT 底物的磷酸化，在 BT474c、LNCaP 和 MDA-MB-468 细胞系中的 IC₅₀ 值为 0.06-0.76 μM。AZD5363 还有效抑制 BT474c 细胞和 LNCaP 细胞中 S6 和 4E-BP1 的磷酸化。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

AZD5363（100, 300 mg/kg；口服给药）处理 BT474c 肿瘤异种移植裸鼠，结果显示 AZD5363 以剂量和时间依赖性的方式减少 PRAS40、GSK3 和 S6 的磷酸化。AZD5363 (300 mg/kg)显著抑制 3 种生物标志物的磷酸化，抑制效果的持续时间至少 24 小时。100 mg/kg 剂量的 AZD5363 显著抑制 3 种生物标志物的磷酸化，抑制效果的持续时间至少 8 小时。^[1]

参考文献

[1] Davies B R, et al. Preclinical pharmacology of AZD5363, an inhibitor of AKT: pharmacodynamics, antitumor activity, and correlation of monotherapy activity with genetic background. *Molecular cancer therapeutics*, 2012, 11(4): 873-887.