

## AZD5363 (Capiwasertib)

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
AZD5363 (Capiwasertib)	53378ES08	5 mg
	53378ES25	25 mg

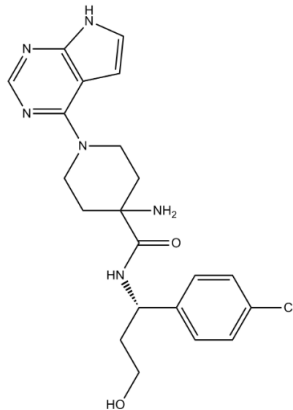
### 产品描述

AZD5363 (Capiwasertib)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 IC<sub>50</sub> 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)	Capiwasertib
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 <sub>21</sub> H <sub>25</sub> ClN <sub>6</sub> O <sub>2</sub>
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 IC<sub>50</sub> 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。<sup>[1]</sup>

### （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。<sup>[1]</sup>

## 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.