

A-674563

产品信息

产品名称	产品编号	规格
A-674563	53382ES08	5 mg
	53382ES10	10 mg

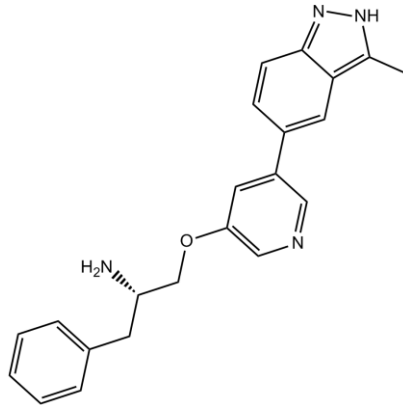
产品描述

A-674563 (A674563)是一种强效的、选择性的 Akt1 抑制剂，其 K_i 值为 11 nM， IC_{50} 值为 14 nM。A-67453 抑制 PKA 和 CDK2 的活性，其 IC_{50} 值分别为 16 nM 和 46 nM。A-674563 作用于 Akt1 比作用于 PKC 选择性高 30 多倍。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	A 674563; A674563
中文名称 (Chinese Name)	Akt1/PKA/CDK2 强效选择性抑制剂
靶点 (Target)	Akt1; PKA; CDK2
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--Akt
CAS 号 (CAS NO.)	552325-73-2
分子式 (Formula)	$C_{22}H_{22}N_4O$
分子量 (Molecular Weight)	358.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
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°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）

A-674563 处理 MiaPaCa-2 细胞 48 小时后，抑制肿瘤细胞的增殖（ $EC_{50} = 0.4 \mu M$ ）。在 STS 细胞中，A-674563 显著降低了 GSK3 和 MDM2 的磷酸化。^[1] A-674563 抑制 Akt 活性，导致 STS 细胞的 G2 期细胞周期阻滞和凋亡。^[2]

（二）动物实验（体内实验）

A-674563（40 mg/kg，每天治疗，连续 21 天）处理携带 PC-3 肿瘤的 SCID 小鼠，并在第 20、24 和 28 天给予紫杉醇（15 mg/kg）治疗，与单独紫杉醇治疗相比，这种联合疗法增加了紫杉醇的疗效。^[1] A-674563 可显著抑制裸鼠体内 HT1080 异种移植肿瘤的生长。^[2]

参考文献

- [1] Luo Y, et al. Potent and selective inhibitors of Akt kinases slow the progress of tumors in vivo. *Mol Cancer Ther.* 2005 Jun;4(6):977-86.
- [2] Zhu QS, et al. Soft tissue sarcoma cells are highly sensitive to AKT blockade: a role for p53-independent up-regulation of GADD45 alpha. *Cancer Res.* 2008 Apr 15;68(8):2895-903.