

AT9283

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53223ES05	2 mg
AT9283	53223ES08	5 mg
	53223ES10	10 mg

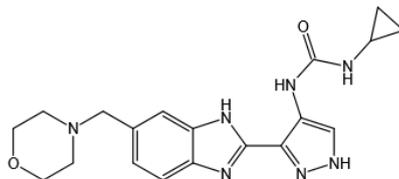
产品描述

AT9283 是一种多靶点激酶抑制剂，包括 Aurora A、Aurora B、JAK3、JAK2 和 Abl，IC₅₀ 分别为 3 nM, 3 nM, 1.1 nM, 1.2 nM 和 4 nM。据报道，AT9283 对白血病细胞、骨髓增殖性疾病和多种实体瘤细胞系具有疗效。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AT9283
中文名称 (Chinese Name)	1-环丙基-3-(3-(5-(吗啉甲基)-1H-苯并[d]咪唑-2-基)-1H-吡唑-4-基)脲
靶点 (Target)	Aurora A, Aurora B, JAK3, JAK2, Abl
通路 (Pathway)	Epigenetics
CAS 号 (CAS NO.)	896466-04-9
分子式 (Formula)	C ₁₉ H ₂₃ N ₇ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	381.43
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO ≥70 mg/mL

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 2 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)

AT9283 作用于 HCT116 细胞, 通过抑制 Aurora B 激酶活性, 产生明显的多倍体表现型, IC_{50} 为 30 nM。AT9283 也有效抑制 HCT116 形成集落。^[1] AT9283 以剂量和时间依赖性方式诱导 B-NHL 细胞凋亡, 并抑制细胞增殖, $IC_{50} < 1 \mu M$ 。^[2] AT9283 抑制骨髓瘤细胞中的 STAT3 酪氨酸磷酸化, 并且以时间依赖性方式诱导细胞生长抑制和细胞凋亡。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

在结肠癌移植瘤小鼠模型中, 给药 AT9283 (15 or 20 mg/kg), 持续 16 天, 显著抑制肿瘤生长, 抑制分别达 67%和 76%。^[1] 在淋巴瘤移植瘤小鼠模型中, 给药 AT9283 (15 mg/kg)和 docetaxel (10 mg/kg), 具有适度的抗肿瘤活性; 而给药 T9283 (20 mg/kg)、AT9283 (15 mg/kg)和 docetaxel (10 mg/kg)表现出显著的肿瘤生长抑制。^[2] 在骨髓瘤移植瘤小鼠模型中, 腹腔注射 AT9283 (45 mg/kg), 抑制肿瘤发展, 提高小鼠存活率。^[3]

参考文献

- [1]. Howard S, et al. Fragment-Based Discovery of the Pyrazol-4-yl Urea (AT9283), a Multitargeted Kinase Inhibitor with Potent Aurora Kinase Activity. *J Med Chem.* 2009 Jan 22;52(2):379-88.
- [2]. Qi W, et al. AT9283, a novel aurora kinase inhibitor, suppresses tumor growth in aggressive B-cell lymphomas. *Int J Cancer.* 2012 Jun 15;130(12):2997-3005.
- [3]. Santo L, et al. Antimyeloma activity of a multitargeted kinase inhibitor, AT9283, via potent Aurora kinase and STAT3 inhibition either alone or in combination with lenalidomide. *Clin Cancer Res.* 2011 May 15;17(10):3259-71.