

AT13148

产品信息

产品名称	产品编号	规格
	53509ES05	2 mg
AT13148	53509ES08	5 mg
	53509ES10	10 mg

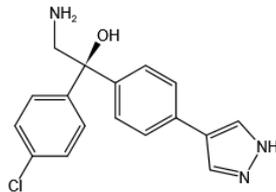
产品描述

AT13148 (AT-13148)是新型可口服的、ATP 竞争性多 AGC kinase 抑制剂，具有强大的药效学和抗肿瘤活性。AT13148 对 Akt1/2/3、PKA、p70S6K 和 ROCK1/II 的 IC₅₀ 分别为 38 nM/402 nM/50 nM、3 nM、8 nM 和 6 nM/4 nM，与其他 AKT 抑制剂作用机制不同，同时抑制多种 AGC 激酶可能会增加抗肿瘤活性并最大限度地减少临床耐药性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	AT13148, AT-13148
靶点 (Target)	Akt1/2/3, p70S6K, PKA, ROCK1/II
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--Akt
CAS 号 (CAS NO.)	1056901-62-2
分子式 (Formula)	C ₁₇ H ₁₆ ClN ₃ O
分子量 (Molecular Weight)	313.78
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）

AT13148, 作为多重 AGC 激酶抑制剂, 有效抑制癌细胞增殖, 对 PI3K-AKT-mTOR 或 RAS-RAF 通路反常的癌细胞系, GI₅₀ 值为 1.5-3.8 μ M。在 PTEN 缺陷型 MES-SA 细胞中, AT13148 也会抑制 AKT 和 p70S6K 信号。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

在人肿瘤（MES-SA、BT474 或 PC3）异种移植物中, AT13148 (50 mg/kg p.o.)显著抑制 AKT 和 p70S6K AGC 激酶的活动, 并表现出显著的抗肿瘤作用。^[1] 在 HGC27 异种移植的小鼠模型中, AT13148(15-45 mg/kg p.o.)显著抑制瘤体生长。^[2]

参考文献

- [1]. Yap TA, et al. AT13148 is a novel, oral multi-AGC kinase inhibitor with potent pharmacodynamic and antitumor activity. *Clin Cancer Res.* 2012 Jul 15;18(14):3912-23.
- [2]. Xi Y, et al. AT13148, a first-in-class multi-AGC kinase inhibitor, potently inhibits gastric cancer cells both in vitro and in vivo. *Biochem Biophys Res Commun.* 2016 Sep 9;478(1):330-6.