

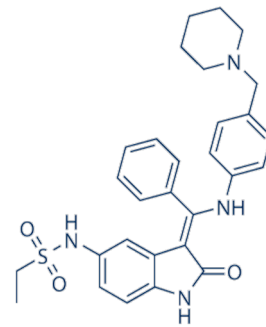
Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6601-10mM	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6601-5mg	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	5mg
SC6601-25mg	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	N-[(3Z)-2-oxo-3-[phenyl-[4-(piperidin-1-ylmethyl)anilino]methylidene]-1H-indol-5-yl]ethanesulfonamide
简称	Hesperadin
别名	Hesperadine
中文名	N/A
化学式	C ₂₉ H ₃₂ N ₄ O ₃ S
分子量	516.65
CAS号	422513-13-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 103mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.97ml DMSO, 或每5.17mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6601-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Hesperadin可有效抑制Aurora B, 无细胞试验中IC ₅₀ 为250nM。它显著降低AMPK、Lck、MKK1、MAPKAP-K1、CHK1和PHK的活性, 但是在体内不会抑制MKK1活性。				
信号通路	Cell Cycle; Epigenetics				
靶点	TbAUK1	Aurora B (human)	—	—	—
IC ₅₀	40nM	250nM	—	—	—
体外研究	Hesperadin抑制磷酸化组蛋白H3的免疫沉淀物Aurora B, IC ₅₀ 为250nM, 且浓度为1μM时明显降低其他激酶(AMPK、Lck、MKK1、MAPKAP-K1、CHK1和PHK)活性。20-100nM Hesperadin作用于HeLa细胞, 诱导有丝分裂的组蛋白H3在Ser10位点的磷酸化作用丧失。Hesperadin处理, 引起有丝分裂和细胞质分裂缺陷, 导致HeLa细胞增殖和多倍体化停止, 这是因为在染色体连接过程中Aurora B功能受抑制。100nM Hesperadin可恢复紫杉醇或Monastrol而不是Nocodazole诱导的有丝分裂停滞。Hesperadin和Nocodazole处理HeLa细胞, 废除BubR1着丝粒区域化, 且降低Bub1在着丝粒处的强度, 说明Aurora B功能对BubR1和Bub1着丝点高效募集是必需的, 可说明对延长检测点信号是必需的。在体外激酶实验中, Hesperadin通过来自致病的锥虫属brucei的T.brucei Aurora激酶-1 (TbAUK1)而阻断重组锥虫组蛋白H3磷酸化, IC ₅₀ 为40nM。Hesperadin明显抑制培养的传染性血液形式(BF)细胞生长, IC ₅₀ 为48nM, 且微弱抑制昆虫循环阶段形式(PF)细胞生长IC ₅₀ 为550nM。				
体内研究	N/A				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	Aurora B激酶实验中, HeLa细胞溶解在含50mM NaCl的buffer中。使用台式离心机对全部细胞抽提物进行离心, 13000rpm 4°C下离心20分钟。200mg全部细胞抽提物在含250mM NaCl的15ml溶解buffer中再次提取, 为了从有丝分裂染色质中获得活性Aurora B激酶。第二次提取的低速悬浮液用于免疫沉淀反应。鼠单抗AIM-1或HA与GammaBind Plus凝胶耦合, 在抽提物中4°C下旋转90分钟。冲洗, 等分, 然后在激酶buffer(20mM Tris, pH 7.5, 150mM NaCl, 10mM MgCl ₂ , 1mM DTT, 10mM NaF)中冲洗。在20μl含5μg组蛋白H3, 10μM ATP, 2.5μCi[γ-32P]ATP和不同浓度Hesperadin的激酶 buffer中进行激酶实验,

	37°C下持续20分钟。加入SDS样本，煮沸，进行SDS-PAGE。烘干凝胶。通过PhosphorImager分析系统测定放射信号。使用ImageQuant软件分析数据。
--	---

细胞实验	
细胞系	HeLa细胞和PtK1细胞
浓度	终浓度为500nM左右
处理时间	24和48小时
方法	不同浓度Hesperadin分别处理细胞24和48小时。在指定时间点，用PBS冲洗甲醇混合的细胞样本，随后在PI buffer(50µg/ml 碘化丙啶, 10mM Tris, pH 7.5, 5mM MgCl ₂ , 200µg/ml RNase A)中37°C下反应20到40分钟。通过流式细胞仪测定DNA量。

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ 参考文献:

1. Hauf S, et al. J Cell Biol, 2003, 161(2), 281-294.
2. Jetton N, et al. Mol Microbiol, 2009, 72(2), 442-458.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6601-10mM	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6601-5mg	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	5mg
SC6601-25mg	Hesperadin (Aurora Kinase抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01