

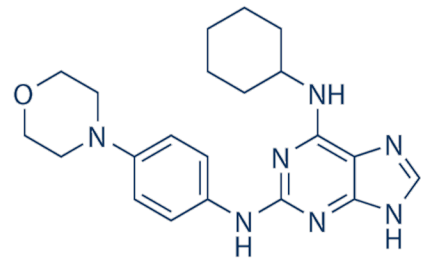
Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2474-10mM	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	10mM×0.2ml
SD2474-5mg	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	5mg
SD2474-25mg	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	6-N-cyclohexyl-2-N-(4-morpholin-4-ylphenyl)-7H-purine-2,6-diamine
简称	Reversine
别名	CHEMBL188343, IN1127
中文名	N/A
化学式	C ₂₁ H ₂₇ N ₇ O
分子量	393.23
CAS号	656820-32-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 5mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.27ml DMSO, 或每3.93mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD2474-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Reversine是一种强效human A3 adenosine receptor拮抗剂, Ki为0.66μM, 也是一种泛aurora A/B/C kinase抑制剂, IC50分别为12nM/13nM/20nM。也用于干细胞分化。				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	Aurora A	Aurora B	Aurora C	human A3 adenosine receptor	—
IC50	12nM	13nM	20nM	0.66μM(Ki)	—
体外研究	Reversine诱导肌源性谱系定向细胞成为多功能间质祖细胞, 其增殖并重新分化为成骨和脂肪细胞。Reversine, 作为一种A3腺苷受体拮抗剂, 在稳定转染的中国仓鼠卵巢(CHO)细胞中, 竞争性抑制毛喉素刺激的cAMP产生。Reversine抑制HCT116细胞中众所周知的Aurora靶点, 组蛋白H3的磷酸化。此外, Reversine有效阻断多种肿瘤细胞的增殖, 并诱导细胞死亡。在原代人肿瘤样品中, Reversine也会抑制白血病细胞的集落形成。联合使用时, reversine和aspirin协同抑制宫颈癌细胞的生长, 并诱导细胞死亡。				
体内研究	在接种U14肿瘤的小鼠体内, 与对照组相比, Reversine(10mg/kg i.p.)和aspirin引起肿瘤重量和体积更多的下降。				
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	A3 AR竞争性结合测定中, 每个试管含有100μl膜悬浮液(20μg 蛋白质), 50μl [125I]4-amino-3-iodobenzyladenosine-5'-N-methyluronamide (0.5nM)和50μl溶于Tris-HCl缓冲液(50mM, pH 7.4)的逐渐增加浓度的测试配体, Tris-HCl缓冲液包含10mM MgCl ₂ 和1mM EDTA。非特异性结合使用10mM 5'-N-ethylcarboxamidoadenosine在缓冲液中测定。混合物在25°C下培养60分钟。结合反应使用MT-24细胞采集器通过Whatman GF/B过滤器减压过滤终止。过滤器用9ml冰预冷的缓冲液清洗3次。放射性使用Beckman γ计数器测定, 计算抑制百分比。

细胞实验	
细胞系	HL-60, A375, HeLa, HCT-116, T47D和MCF-7细胞系
浓度	~10μM

处理时间	72小时
方法	不同肿瘤细胞系的细胞活性使用ATPlite 1step进行评估。简而言之，逐渐增加数量的reversine存在下，每孔以 2×10^4 个细胞接种于96孔板。72小时后，将板恢复，且每孔加入100 μ l ATPlite溶液。板在700rpm下振荡2分钟，荧光使用EnVision多标记板阅读器测量。每个样品以一式三份进行分析。

动物实验	
动物模型	负荷U14肿瘤的小鼠
配制	DMSO
剂量	每3天，10mg/kg
给药方式	i.p.

➤ **参考文献：**

- 1.Chen S, et al. J Am Chem Soc. 2004, 126(2), 410-411.
- 2.Perreira M, et al. J Med Chem. 2005, 48(15), 4910-4918.
- 3.D'Alise AM, et al. Mol Cancer Ther. 2008, 7(5), 1140-1149.
- 4.Qin HX, et al. Cytotechnology. 2013, 65(4), 643-653.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SD2474-10mM	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	10mM \times 0.2ml
SD2474-5mg	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	5mg
SD2474-25mg	Reversine (Adenosine Receptor拮抗剂)	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：

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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成高浓度的储备液(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