

SB743921

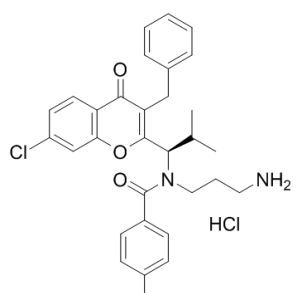
产品编号: MB4033

质量标准: >98%

包装规格: 5MG;10MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C31H33N2O3.HCl	结 构 式	
分子量	553.52		
CAS No.	940929-33-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 111 mg/mL (200.53 mM)		
	Water: 22 mg/mL (39.74 mM)		
	Ethanol: 111 mg/mL (200.53 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介: SB-743921 是一种有效的驱动蛋白 (Eg5) 抑制剂。

别名: Benzamide,

N-(3-aminopropyl)-N-[(1R)-1-[7-chloro-4-oxo-3-(phenylmethyl)-4H-1-benzopyran-2-yl]-2-methylpropyl]-4-methyl-, hydrochloride (1:1)

物理性状及指标:

外观:淡黄色至黄色固体

溶解性:DMSO: 111 mg/mL (200.53 mM); Water: 22 mg/mL (39.74 mM); Ethanol: 111 mg/mL (200.53 mM)

含量:>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	SB 743921 是 kinesin spindle protein (KSP) (纺锤体驱动蛋白) 抑制剂, Ki 为 0.1 nM, 对 MKLP1, Kin2, Kif1A, Kif15, KHC, Kif4 和 CENP-E 几乎没有亲和力。				
靶点	SKOV3 细胞	Colo205 细胞	MV522 细胞	MX1 细胞	P388 细胞
IC50	0.2 Nm	0.07 nM	1.7 nM	0.06 nM	14.4 nM
体外研究	SB 743921 对于人和鼠的 KSP 的 Ki 值分别是 0.1 nM 和 0.12 nM, 而对其它的驱动蛋白 MKLP1 和 Kin2, 其 Ki 值则大于 70 μM。SB 743921 阻断了功能性有丝分裂纺锤体的组装, 因此能将细胞阻断在有丝分裂期并随后导致细胞坏死。SB-743921 对 ispinesib 的效能已经分别在生化和细胞实验中得到改善。				
体内研究	在体内 SB-743921 能有效抑制 P388 白血病。不同于紫杉烷, SB-743921 对广谱肿瘤模型都有显				

	著效应。SB-743921 对异种移植人的肿瘤 Colo205 (完全回归), MCF-7, SK-MES, H69, OVCAR-3 (完全和部分回归) 和 HT-29, MX-1, MDA-MB-231, A2780 (肿瘤生长延迟)都能产生抑制增长的活性。SB-743921 不会引起经常与微管蛋白相关的神经病变。
特征	SB-743921 是第二代 KSP 抑制剂

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB4032	Ispinesib (SB-715992)
MB4033	SB743921

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。SB 743921 是 kinesin spindle protein (KSP) (纺锤体驱动蛋白) 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8066 mL	9.0331 mL	18.0662 mL
5 mM	0.3613 mL	1.8066 mL	3.6132 mL
10 mM	0.1807 mL	0.9033 mL	1.8066 mL
50 mM	0.0361 mL	0.1807 mL	0.3613 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>生化实验: 用大肠杆菌 BL21(DE3)表达 COOH 端标记 6 个组氨酸的 KSP 蛋白的马达结构域 (1-360 位氨基酸)。在 microfluidizer 中用裂解液 [50 mM Tris-HCl; 50 mM KCl, 10 mM 咪唑, 2 mM MgCl₂, 8 mM β-巯基乙醇, 0.1 mM ATP (pH 7.4)]裂解菌体, 在用 Ni-NTA 琼脂糖亲和层析的方法纯化蛋白, 并用洗脱液 [50 mM PIPES, 10% 蔗糖, 300 mM 咪唑, 50 mM KCl, 2 mM MgCl₂, mM β-巯基乙醇, 0.1 mM ATP (pH 6.8)]将蛋白洗脱下来。丙酮酸激酶-乳酸脱氢酶检测系统能够将 ADP 外露部分与 NADH 的氧机偶联, 因此可以利用这个系统来测量 ATPase 的活性的稳定性。然后检测 340 nm 的吸光度变化。所有生化实验都在 PEM25 的缓冲液 [25 mM Pipes/KOH (pH 6.8), 2 mM MgCl₂, 1 mM EGTA]中进行, 而实验涉及微管时则需要另加 10 μM SB 743921。可以用中止流仪器通过检测 MANT-ATP 荧光的减少来检测 ADP 的释放率。也可以用 7-二乙氨-3-(((2 顺丁烯二酰亚氨基)乙烷基)氨基)羧基)香豆素(MDCC)染料修饰 Pi, 然后通过中止流仪器检测 Pi 的释放率。之后可以做出 KSP 抑制剂的剂量响应曲线, 用酶浓度明确修正结果后, 就可以估算出 KSP 抑制剂的 K_i 值。微管蛋白的聚合则可以通过检测 340 nm 处吸光度的变化来测量, 反应体系为 100-μL, 在 96 孔板中进行, 并将酶标仪的孵育温度设置成 37°C</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HeLa 细胞 Concentrations: 1 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 用含 10% FCS 的 RPMI 1640 培养基, 在 5% CO₂ 的条件下培养包括 HeLa 细胞在内的所有细胞。在 96 孔微量滴定板中利用</p>

	<p>3-(4,5-dimethylthiazol-2-yl)-5-(3-carboxymethoxyphenyl)-2-(4-sulfophenyl)-2H-tetrazolium 我们检测了 48 小时内连续稀释的 SB 743921 对 DMSO 处理的细胞的生长抑制作用。将用 DMSO 处理的细胞的吸光度比率当成细胞的生长情况，绘制成浓度对应的四参数曲线。从拟合曲线中可以推测出细胞生长被抑制 50% 时的药物浓度。可以用碘化丙啶染色及流式细胞技术估测用 1 μM SB 743921 处理或不用 SB 743921 处理的 HeLa 细胞中的 DNA 含量。还可以用免疫荧光的技术来检测，首先用 1 μM SB 743921 处理 HeLa 细胞 24 小时，再用 2% 甲醛固定，通透后再用 DM1-α, anti-γ-tubulin, 和 1 $\mu\text{g}/\text{mL}$ 4',6-diamidino-2-phenylindole 染色，再用 Alexa 488 secondary goat antirabbit IgG 和 Rhodamine-X goat antimouse IgG 孵育，最后拍照得到免疫荧光结果的图片。图片是用 DeltaVision Restoration Microscopy System 放大 600 倍得到的。收集 Z stacks (0.2 μm) 的结果并把模糊的信息通过约束迭代卷积去除掉。然后把 Z stacks 压缩成单像平面。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 携带淋巴球性白血病细胞 P388 的雌性 BDF1 小鼠 Formulation: 2% 二甲基乙酰胺 + 2% 聚氧乙烯蓖麻油 + 96% 酸化水 [pH 5.0] Dosages: 7.5 mg/kg- 30 mg/kg Administration: 腹腔注射</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12

兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。