

BIIB021

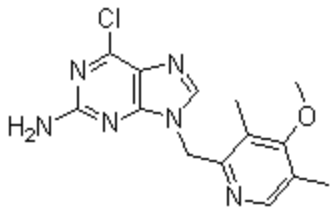
产品编号: MB4058

质量标准: >98%, HSP90 抑制剂

包装规格: 5MG;25MG;50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C14H15ClN6O	结 构 式	
分子量	318.76		
CAS No.	848695-25-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 64 mg/mL (200.77 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 2 mg/mL (6.27 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: BIIB021 是一种可口服的全合成的 HSP90 抑制剂。

别名: CNF2024; 9H-Purin-2-amine, 6-chloro-9-[(4-methoxy-3,5-dimethyl-2-pyridinyl)methyl]-

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 64 mg/mL (200.77 mM); Water Insoluble; Ethanol: 2 mg/mL (6.27 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	BIIB021(CNF2024) 是口服有效的, 全部人工合成的, 小分子 HSP90 抑制剂, Ki 和 EC50 分别为 1.7 nM 和 38 nM。
靶点	Hsp90
IC50	EC50 为 38 nM, Ki 为 1.7 nM。
体外研究	BIIB021 结合到 Hsp90 的 ATP 结合袋中, 干涉 Hsp90 伴侣功能, 导致客户蛋白降解和肿瘤生长受抑制。BIIB021 抑制肿瘤细胞 (BT474, MCF-7, N87, HT29, H1650, H1299, H69 和 H82) 增殖, IC50 为 0.06-0.31 μM。BIIB021 诱导 Hsp90 客户蛋白包括 HER-2, AKT, 和 Raf-1 的降解, 以及正向调节 Hsp70 和 Hsp27。BIIB021 抑制 Hodgkin's 淋巴瘤细胞(KM-H2, L428, L540, L540cy, L591, L1236 和 DEV), IC50 为 0.24-0.8 μM。BIIB021 作用于健康个体的淋巴细胞时活性低。BIIB021 抑制 NF-κB 活性。BIIB021 诱导 Hodgkin's 淋巴瘤细胞中激活 NK 细胞受体 NKG2D 配体的表达, 导致对 NK 细胞调节的死亡敏感性上升。在体外, BIIB021 增强 HNSCCA 细胞系(UM11B 和 JHU12)的放射敏感性, 伴随关键放射反应蛋白的表达下降, 增强凋亡细胞和增强 G2 期捕获。在

	体内外, 与 17-AAG 相比, 作用于肾上腺皮质癌 H295R, BIIB021 更有效。BIIB021 的细胞毒性不受 NQO1 或 Bcl-2 过量表达缺失影响, 分子损伤与 17-AAG 降低细胞杀伤力有关。BIIB021 作用于抗 17-AAG 细胞系(NIH-H69, MES SA Dx5, NCI-ADR-RES, Nalm6 等等)也有效。
体内研究	BIIB021 口服处理多种移植瘤模型 (包括 N87, BT474, CWR22, U87, SKOV3 和 Panc-1) 导致肿瘤生长受抑制。BIIB021 按 120 mg/kg 剂量处理 L540cy 肿瘤, 有效抑制肿瘤的生长。BIIB021 作用于 JHU12 移植瘤, 明显增强抗肿瘤生长功效。
特征	BIIB021 是全人工合成的口服 Hsp90 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)

MB4659	VER-155008
MB4056	Elesclomol (STA-4783)

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。BIIB021 是一种可口服的全合成的 HSP90 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	3.1372 mL	15.6858 mL	31.3716 mL
5 mM	0.6274 mL	3.1372 mL	6.2743 mL
10 mM	0.3137 mL	1.5686 mL	3.1372 mL
50 mM	0.0627 mL	0.3137 mL	0.6274 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>Hsp90 结合实验: 用于荧光偏振竞争测量, FITC-geldanamycin 探针 (20 nM) 和 2 mM TCEP 在室温下 进行 3 小时, 然后等分置于 -80°C 储存。重组人类 Hsp90α (0.8 nM) 和降低的 FITC-geldanamycin (2 nM) 在 含有实验 buffer 的 96 孔板上 在室温下温育 3 小时, 实验 buffer 包含 20 mM HEPES (pH 为 7.4), 50 mM KCl, 5 mM MgCl₂, 20 mM Na₂MoO₄, 2 mM DTT, 0.1 mg/mL BGG, 和 0.1% (v/v) CHAPS。预温育后, 加入溶于 100% DMSO 的 BIIB021 , 最终浓度为 0.2 nM 到 10 μM (最终体积为 100 μL, 2% DMSO)。反应在室温下进行 16 小时, 在 485 和 535 nm 处测定荧光值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: BT474, MCF-7, N87, HT29, H1650, H1299, H69 和 H82 细胞 Concentrations: 3 到 1×10³ nM Incubation Time: 5 天 Method: 使用修改的四唑鎓盐法测定 IC50 值。肿瘤细胞加到 96 孔板上繁殖 24 小时, 然后加入 BIIB021。对照组加入 DMSO (0.03-0.003%)。吩嗪硫酸甲酯(储存浓度为 1 mg/mL) 和 3-(4,5-二甲基噻唑-2-基)-5-(3-羧甲羟苯基)-2-(4-磺苯基)-2 氢-四唑, 内盐 (储存浓度为 2 mg/mL) 按 1:20 混合, 加到 96 孔板的每孔中, 温育。3-(4,5-二甲基噻唑-2-基)-5-(3-羧甲羟苯基)-2-(4-磺苯基)-2 氢-四唑, 内盐的降低, 导致可溶性甲臌分泌到培养基中。温育 4 小时, 在 490 纳米处使用分光光</p>

	度计测量甲臆。使用 SOFTmaxPRO 软件获得数据, 100% 生存力定义为用 DMSO 处理的细胞 A490, 用 3-(4,5-二甲基噻唑-2-基)-5-(3-羧甲羟苯基)-2-(4-磺苯基)-2 氢-四唑, 内盐(用 DMSO 处理细胞的平均 A490 为 0.03-0.003%)染色通过 A ₄₉₀ 值计算每个样本存活百分数, 计算按如下: 存活率 (%) = (A _{490 nm} 样本 / A _{490 nm} DMSO 处理的细胞 × 100)。
动物实验	<p>Animal Models: BALB/c 和无胸腺鼠中的 N87, BT474, CWR22, U87, SKOV3 和 Panc-1 肿瘤模型</p> <p>Formulation: 磷脂/蔗糖乳剂</p> <p>Dosages: 31, 62.5, 和 125 mg/kg</p> <p>Administration: 每天口服处理一次</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。如需制备储备液, 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。