YM155

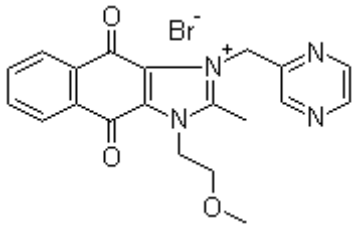
产品编号：MB4082

质量标准：>98%，survivin 抑制剂

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C20H19BrN4O3	结构式	
分子量	443.29		
CAS No.	781661-94-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO： 55 mg/mL (124.07 mM)		
	Water： 89 mg/mL (200.77 mM)		
	Ethanol ：6 mg/mL (13.53 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：YM-155 是 survivin 抑制剂。

别名：Sepantronium bromide；1H-Naphth[2,3-d]imidazolium, 4,9-dihydro-1-(2-methoxyethyl)-2-methyl-4,9-dioxo-3-(2- pyrazinylmethyl)-, bromide (1:1)

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO： 55 mg/mL (124.07 mM)；Water： 89 mg/mL (200.77 mM)；Ethanol ：6 mg/mL (13.53 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	YM155 (Sepantronium Bromide)是一种有效的 survivin 抑制药，通过抑制 Survivin 启动子活性而发挥作用，在 HeLa-SURP-luc 和 CHO-SV40-luc 细胞中 IC50 为 0.54 nM；对 SV40 启动子活性抑制作用不显著，能够轻微抑制 Survivin 与 XIAP 相互作用。Phase 2。
靶点	Survivin (HeLa-SURP-luc, CHO-SV40-luc cells)

	0.54 nM
体外研究	YM155 30 μM 时对 SV40 作用效果也不大。在 p53 缺陷的 PC-3 和 PPC-1 人类 HRPC 细胞中，通过抑制 survivin 基因启动子的转录，YM155 显著抑制内源性 survivin 的表达。相反，YM155 100 nM 时对 c-IAP2, XIAP, Bcl-2, Bcl-xL, Bad, α-actin,及 β-tubulin 的蛋白表达仍没抑制效果。YM155 作用于人类癌细胞系包括 PC-3 和 PPC-1，使细胞发生凋亡，伴随着 caspase-3 活性上升。YM155 有效抑制人类癌细胞系(突变 p53 或短小 p53) 包括 PC-3, PPC-1, DU145, TSU-Pr1, 22Rv1, SK-MEL-5 及 A375 ，IC50 值为 2.3 到 11 nM。另外，YM155 增强 NSCLC 细胞对 γ-射线的敏感性。YM155 和 γ-射线联用，增强凋亡细胞数和 caspase-3 活性。 YM155 推迟修复放射诱导核 DNA 断裂的双链。
体内研究	YM155 按 3 和 10 mg/kg 皮下注射前列腺移植瘤，结果显示 YM155 完全抑制 PC-3 的肿瘤生长，但是重量没有降低，血细胞数也没有下降。药物动力学分析显示 YM155 作用于肿瘤组织效果很明显。而且，YM155 按 5 mg/kg 作用于 PC-3 常位移植瘤时肿瘤抑制率达 80% 。YM155 和 γ-射线联用作用于携带 H460 或 Calu6 移植瘤的裸鼠，显示出强抗癌活性。

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。YM-155 是 survivin 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 \ 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2559 mL	11.2793 mL	22.5586 mL
5 mM	0.4512 mL	2.2559 mL	4.5117 mL
10 mM	0.2256 mL	1.1279 mL	2.2559 mL
50 mM	0.0451 mL	0.2256 mL	0.4512 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	**启动子-荧光酶素报告实验:** 使用 Pyrobest 聚合酶和引物 5’-GCGCGCTCGAGTCTAGACATGCGGATATATTC-3’ 和 5’-GCGCGAA-GCTTTGGCGGTTAATGGCGCGC-3’ ，从人类基因组 DNA 中分离 2767 个碱基对序列的人类 survivin 基因启动子。在 pGL3-Basic 质粒的 XhoI/HindIII 切除位点，内切酶 XhoI/HindIII 切除产生的 PCR 片段。产生的质粒称为 pSUR-luc。通过 DNA 测序仪在所有增强序列处测定 DNA 序列。通过荧光酶素实验，使用短暂转染的 HeLa-S3 细胞，测定 pSUR-luc 的活力。使用的 pGL3 质粒含有 SV40 启动子和增强子序列。 pSUR-luc 和 pSV2bsr 质粒通过 Lipofectamin2000 稳定转染到 HeLa 细胞中。加入 10 μg/mL 灭瘟素，根据适当的荧光酶素信号和基因稳定性，筛选 HeLa-SURP-luc 单一群落。pGL3 和

	pSV2bsr 质粒稳定转染到 CHO 细胞中。加入 10 μg/mL 灭瘟素，根据适当的荧光酶素信号和基因稳定性，筛选 CHO-SV40-luc 单一群落。从 HeLa-SURP-luc 和 CHO-SV40-luc 群落中获得细胞用于化学筛选。细胞按每孔 5×10^3 接种在 96 孔板上，加入 YM155（溶于 DMSO 中）。24 小时后测定荧光酶素活性。通过回归分析计算 IC50 值。
细胞实验	**Cell lines:** PC-3, PPC-1, DU145, TSU-Pr1, 22Rv1, SK-MEL-5，和 A375 细胞 **Concentrations:** ~ 100 nM **Incubation Time:** 48 小时 **Method:** PC-3, PPC-1, DU145, TSU-Pr1, 22Rv1, SK-MEL-5，及 A375 细胞系按 5 到 40×10^3 密度接种在 96 孔板上。YM155 溶解在 DMSO 中，持续处理细胞 48 小时。通过 sulforhodamine B 试剂测定细胞数。
动物实验	**Animal Models:** 皮下注射 PC-3 移植瘤的雄性裸鼠(BALB/c nu/nu) **Formulation:** 溶于盐溶液，再用盐溶液稀释。 **Dosages:** 5 mg/kg **Administration:** 皮下注射，每周持续处理 3 天，处理 3 周。

【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。