

VER-155008; VER155008

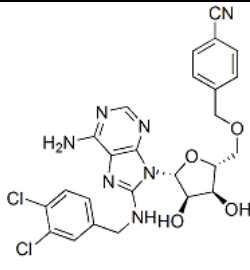
产品编号: MB4659

质量标准: >98%,BR

包装规格: 10MG; 50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₃ Cl ₂ N ₇ O ₄	结构式	
分子量	556.4 (无水)		
CAS No.	1134156-31-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 100 mg/mL (179.73 mM) Water Insoluble Alcohol Insoluble		
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: VER-155008 是一种 **Hsp70** 的抑制剂。

别名: 4-((((2R,3S,4R,5R)-5-(8-(3,4-dichlorobenzylamino)-6-amino-9H-purin-9-yl)-3,4-dihydroxy-tetrahydrofuran-2-yl)methoxy)methyl)benzonitrile

物理性状及指标:

外观:白色至粉色粉末

溶解性:DMSO 100 mg/mL (179.73 mM);Water Insoluble;Alcohol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	VER-155008 是一种有效的 Hsp70 家族抑制剂, 无细胞试验中对 HSP70, HSC70, 和 GRP78 的 IC50 分别为 0.5 μM, 2.6 μM, 和 2.6 μM, 比作用于 HSP90 选择性高 100 多倍。		
靶点	HSP70 (Cell-free assay)	HSC70 (Cell-free assay)	GRP78 (Cell-free assay)
	0.5 μM	2.6 μM	2.6 μM

体外研究	VER-155008 抑制人乳腺癌和结肠癌细胞系 BT474, MB-468, HCT116, 和 HT29 的增殖, GI50s 的范围为 5.3-14.4 μM , 并且在 HCT116 和 BT474 细胞中诱导 Hsp90 客户蛋白降解。在 8505C 和 FRO 细胞中, VER-155008 时间和剂量依赖性降低细胞活性, 并提高死亡细胞百分比。VER-155008 以剂量依赖的方式抑制细胞因子依赖性 AML 细胞增殖。VER-155008 在 A549 和 H1975 细胞中对细胞增殖表现出有效的抑制作用。
体内研究	在负荷 HCT116 肿瘤的小鼠体内, VER-155008 (25 或 40 mg/kg, i.v.)快速代谢和清除, 伴随肿瘤水平低于预测的药理学活性水平。

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。VER-155008 是一种 **Hsp70** 的抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置:

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7973 mL	8.9863 mL	17.9727 mL
5 mM	0.3595 mL	1.7973 mL	3.5945 mL
10 mM	0.1797 mL	0.8986 mL	1.7973 mL
50 mM	0.0359 mL	0.1797 mL	0.3595 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验	<p>Hsc70, Hsp70 和 Grp78 荧光偏振(FP)试验:</p> <p>Hsp70 的 FP 试验在包含 100 mM Tris pH 7.4, 150 mM KCl 和 5 mM CaCl₂ 的 100 μl 终体积缓冲液中, 使用 96 孔黑色聚苯乙烯高结合板和 Fusion 酶标仪进行。N⁶-(6-amino)hexyl-ATP-5-FAM 和 GST-HSP70 3-382 的自身蛋白质制剂在试验缓冲液中的终浓度分别为 20 nM 和 400 nM。化合物以 10 倍的 IC₅₀s 测定, 终 DMSO 浓度为 5%。在 Fusion (ex 485 nm; em 535 nm)读取数据之前, 试验混合物培育 3 小时。数据使用 4 参数 logistical 数据模型通过 XLFit 4 拟合。Hsc70 和 Grp78 的 FP 试验同 Hsp70 进行, 使用相同的 N6-(6-amino)hexyl-ATP-5-FAM 作为 FP 探针, 做以下修改。对于 Hsc70, 蛋白质和探针浓度分别为 0.3 μM 和 20 nM, 在 22$^{\circ}\text{C}$ 下培育 30 分钟, 而对 Grp78, 蛋白质和探针浓度分别为 2 μM 和 10 nM, 在 22$^{\circ}\text{C}$ 下培育 2 小时。FAM-ATP 探针的 K^D 对 Hsc70 和 Grp78 分别为 0.24 μM 和 2 μM。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: BT474, MB-468, HCT116, 和 HT29 细胞</p> <p>Concentrations: 50 μM</p> <p>Incubation Time: 72 h</p> <p>Method: 所有细胞系在 DMEM/10% FCS 和 GlutaMAX-I 中, 于 5% CO₂ 的潮湿大气中生长。细胞增殖试验 sulforhodamine B (SRB)试验测定。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 负荷 HCT116 肿瘤的小鼠</p> <p>Formulation: 10% DMSO/5% Tween 80/85% 盐水 (v/v/v)</p> <p>Dosages: 40 mg/kg</p> <p>Administration: i.v.</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(M ²)	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。