

Ganetespib ; STA-9090 ; STA9090

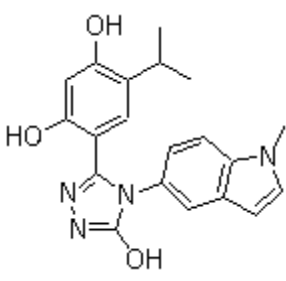
产品编号：MB5150

质量标准：>98%，HSP90 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C20H20N4O3	结 构 式	
分子量	364.4		
CAS No.	888216-25-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：40 mg/mL (109.76 mM) Water Insoluble Ethanol 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：Ganetespib 是一种热休克蛋白 90 (HSP90) 抑制剂，在多种血液和实体肿瘤细胞系中表现出有效的细胞毒性。

别名：STA-9090;STA 9090;STA9090 ; ganetespib;STA-9090;STA 9090;STA9090 ;

3-(2,4-dihydroxy-5-isopropylphenyl)-4-(1-methylindol-5-yl)-5-hydroxy-4h-1,2,4-triazole

物理性状及指标：

外观：.....白色至黄色粉末

溶解性：.....DMSO：40 mg/mL (109.76 mM);Water Insoluble;Ethanol Insoluble

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	Ganetespib (STA-9090)是一种 HSP90 抑制剂，在 OSA 8 种细胞中 IC50 为 4 nM，诱导 OSA 细胞凋亡，而不影响正常的成骨细胞；是 STA-1474 的活性代谢物。
靶点	HSP90 (OSA 8 cells) 4 nM
体外研究	Ganetespib 对恶性肥大细胞系的 50%抑制浓度(IC50)比对 17-AAG 低 10-15 倍，表明三唑酮类 HSP90 抑制剂可能比格尔德霉素类抑制剂具有更高的效能。Ganetespib 抑制 MG63 细胞系，IC50 为 43 nM。Ganetespib 结合于 Hsp90 的 N 末端 ATP 结合域，通过引起多重致瘤性 Hsp90 受体蛋白，包括 HER2/neu，突变型 EGFR，Akt，c-Kit，IGF-1R，PDGFRα，Jak1，Jak2，STAT3，STAT5，HIF-1α，CDC2 和 c-Met 以及 Wilms' tumor 1 的降解，成为一种有效的 Hsp90 的抑制剂。Ganetespib，在纳摩尔级低浓度下，有效阻滞细胞增殖，

	<p>并诱导广泛的人肿瘤细胞系凋亡，并且对许多受体酪氨酸激酶抑制剂-和 tanespimycin-耐受的细胞系也具有作用。Ganetespiib 在一系列固体和血液肿瘤细胞系，包括那些对小分子酪氨酸激酶抑制剂耐受的表达突变激酶的细胞系，都表现出有效的细胞毒性。Ganetespiib 治疗快速引起已知的 Hsp90 受体蛋白降解，表现出高于 ansamycin 抑制剂 17-AAG 的效能，并且在较短的暴露时间下也具有持续的活性。在另一个研究中，Ganetespiib 诱导恶性犬肥大细胞系凋亡。Ganetespiib 在非常低的浓度下，有效作用于 C2 和 BR 犬恶性肥大细胞，IC50 分别为 19 和 4 nM，而 17-AAG 抑制 C2 和 BR 犬恶性肥大细胞的 IC50 分别为 958 和 44 nM。100 nM Ganetespiib 处理 24 小时后，所有处理过的细胞系，包括 C2 和 BMCMCs 细胞中 WT 和突变型 Kit 的表达被下调。然而，Ganetespiib 处理后不影响 PI3K 或 HSP90 的表达。</p>
体内研究	<p>Ganetespiib 给药导致几种肿瘤异种移植模型的小鼠体内肿瘤显著缩减，且似乎毒性较低。此外，与 tanespimycin 相比，Ganetespiib 具有更好的肿瘤渗透性。在恶性肥大细胞和 OSA 异种移植模型中，Ganetespiib 抑制体内肿瘤生长。Ganetespiib(25 mg/kg/day, 3 天)重复两个周期显著抑制肿瘤生长，%T/C 值为 18。Ganetespiib 能够被很好的耐受，载体对照和 Ganetespiib 组相对于研究开始时的平均体重改变在第 17 天使分别为+0.3% 和-8.1%。</p>

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)

MB1634	17-AAG
MB4678	AT13387
MB4058	BIIB021
MB4695	NVP-BEP800

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。Ganetespiib 是一种热休克蛋白 90 (HSP90) 抑制剂,本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7442 mL	13.7212 mL	27.4424 mL
5 mM	0.5488 mL	2.7442 mL	5.4885 mL
10 mM	0.2744 mL	1.3721 mL	2.7442 mL
50 mM	0.0549 mL	0.2744 mL	0.5488 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验：	<p>Cell lines: OSA 细胞 Concentrations: 0.001-1μM Incubation Time: 5 天 Method: 将 1.5×10^3 OSA 细胞接种于 96 孔板,在包含 10%血清的完全培养基中培养过夜,以测定 50%抑制浓度。板在第 5 天采集,随后用 0.001, 0.005, 0.01, 0.05, 0.1, 0.5 和 1 μM Ganetespiib 处理并分析。荧光测量使用酶标仪在 485 nm 激发波长和 530 nm 发射检测波长下进行。相对细胞数以对照孔的百分比计算: 样品吸光度/DMSO 处理的细胞吸光度 \times 100。</p>
--------------	--

动物实验：	Animal Models: 雌性严重的联合免疫缺陷(SCID)小鼠 Formulation: 在 DMSO 中用 20% Cremophor RH 40 以 1:10 稀释 Dosages: 25 mg/kg/day, 持续 3 天 Administration: 尾部静脉注射
-------	---

【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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。