

## PUH71 ; PU-H71

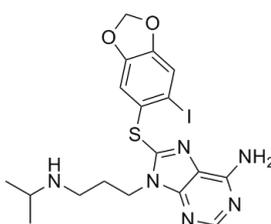
产品编号 : MB5161

质量标准 : >95%,HSP90抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C18H21N6O2S	结 构 式	
分子量	512.37		
CAS No.	873436-91-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 100 mg/mL (195.17 mM)		
	Water 34 mg/mL warmed (66.35 mM)		
	Ethanol 100 mg/mL (195.17 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 :** PU-H71 是一种有效的 Hsp90 抑制剂。

**别名 :** 9H-Purine-9-propanamine, 6-amino-8-[(6-iodo-1,3-benzodioxol-5-yl)thio]-N-(1-methylethyl)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO 100 mg/mL (195.17 mM) ; Water 34 mg/mL warmed (66.35 mM) ;  
Ethanol 100 mg/mL (195.17 mM)

含量 : .....>95%

**储存条件 :** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	PU-H71 是有效的选择性 HSP90 抑制剂, IC50 为 51 nM。
特性	Purine-based, HSP90-selective inhibitor.
靶点	HSP90

	51 nM
体外研究	<p>PU-H71(1 μM)有效抑制三阴性乳腺癌(TNBC) 细胞系 MDA-MB-468, MDA-MB-231, 和 HCC-1806 生长, IC50 分别为 65, 140 和 87 nM。PU-H71(1 μM) 分别杀死 80%, 65%,和 80%的 MDA-MB-468, MDA-MB-231, 和 HCC-1806 细胞。PU-H71 (0.25-1 μM)诱导肿瘤驱动分子降解和失活, 包括 EGFR, IGF1R, HER3, c-Kit, Raf-1 和 Akt。1 μM PU-H71 处理 24 小时, 增强 MDA-MB-468 细胞在 G2-M 期百分比, 达到 69%, 通过减少 CDK1 和 Chk1 表达来介导的。PU-H71 作用于 TNBC, 通过下调 Akt 和 Bcl-xL, 及抑制其活性, 而诱导细胞凋亡。0.5 和 1μM PU-H71 作用于 MDA-MB-231 细胞, 降低蛋白酶体介导的 IRAK-1 和 TBK1 水平, NF-κB 活性分别降低约 84%和 90%。PU-H71 显著抑制 MDA-MB-231 细胞入侵, 1 μM 时抑制 90%。PU-H71 (2.5 μM) 产生内质网 (ER) 应激, 及通过 XBP1 mRNA 剪接 (2.3 倍), 激活未折叠蛋白反应 (UPR), 且上调 Grp94(3.7 倍), Grp78(4.9 倍) 和 CHOP(48 倍) 蛋白表达和 ATF4(1.8 倍) mRNA 表达。PU-H71 (1 μM)作用于 HeLa 细胞, 诱导细胞凋亡的线粒体途径, 通过 caspase 而非 calpain 激活介导。为了应对 PU-H71 诱导的内质网应激, 在黑色素瘤, 子宫颈癌, 结肠癌, 肝癌和肺癌细胞, 而非正常人成纤维细胞中触发细胞凋亡。PU-H71 可以克服 Bcl-2 抗性而诱导细胞凋亡。PU-H71 (30 nM) 作用于 LI(1 μg/mL LPS 和 5 ng/mL IFN γ)刺激的星形胶质细胞, 通过抑制 NF-κB 激活, 而显著降低 NOS2 活性(降低 60%) 和表达。PU-H71 作用于小胶质细胞和星形胶质细胞, 具有相似的作用效果, 50nM PU-H71 显著降低 LPS 依赖性的亚硝酸盐释放。</p>
体内研究	<p>PU-H71 按 75 mg/kg 剂量处理 MDA-MB-231 模型, 100%完全起作用, 处理 37 天后, 肿瘤被疤痕组织所取代, 伴随着降低许多增殖和抗凋亡分子, EGFR, HER3, Raf-1, Akt, 和 p-Akt 分别降低 80%, 95%, 99%, 80%和 65%。PU-H71 (75 mg/kg, 每周三次)抑制 96%肿瘤生长, 降低 60%肿瘤细胞增殖, 与存活和高浸润性潜能相关的活化 Akt 降低 85%, 细胞凋亡增加 6 倍。</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)

MB5150	STA-9090;STA9090
MB1634	17-AAG
MB4678	AT13387

**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。PU-H71 是一种有效的 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	1.9517 mL	9.7586 mL	19.5171 mL
5 mM	0.3903 mL	1.9517 mL	3.9034 mL

10 mM	0.1952 mL	0.9759 mL	1.9517 mL
50 mM	0.0390 mL	0.1952 mL	0.3903 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>HSP90 结合试验:</b> 在黑色 96 孔微量滴定板中进行测量。通过破坏细胞膜制备细胞裂解液，冷冻在-70°C 下，在添加蛋白酶和磷酸酶抑制剂的 HFB[20 mM Hepes (K), pH 7.3, 50 mM KCl, 5 mM MgCl<sub>2</sub>, 20 mM Na<sub>2</sub>MoO<sub>4</sub>, 0.01% Nonidet P-40]中溶解细胞提取物。使用荧光标记的 Geldanamycin(Cy3B-GM)(3 nM) 处理量不断增多的细胞裂解液，记录饱和曲线。导致极化 ( mP ) 的裂解液量对应于竞争研究中的 90%-99% 结合配体。每组 96 孔板包含 3 nM Cy3B-GM, 细胞裂解液(通过 Western blot 分析，使用从 HeLa 细胞纯化的 Hsp90 作为标准，测定量且归一化为总 Hsp90) 和试验 Hsp90 抑制剂，终浓度为 100 μL。实验板在摇床上 4°C 下放置 24 小时，记录 mP 中的荧光偏振 ( FP ) 值。置换 50% Cy3B-GM 所需的浓度定义为 EC50 值。使用 Analyst GT 酶标仪进行 FP 测量。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 人类三阴性乳腺癌细胞系 MDA-MB-231 <b>Concentrations:</b> ~5μM <b>Incubation Time:</b> 3 天 <b>Method:</b> 指数生长的 MDA-MB-231 细胞接种到黑色 96 孔微量滴定板中，在含对照 ( DMSO ) 或化合物的培养基中在指定时间在 37°C 下温育。每组实验条件下，实验板含 3 个重复孔，孔中为 100μL 培养基，其中每孔接种 8×10<sup>3</sup> 个细胞。Hsp90 抑制剂处理细胞后，实验板平衡至室温 ( 20-25°C ) 约 30 分钟，然后每孔加入 100 μL CellTiter-Glo 试剂。实验板在定轨摇床上混合 2 分钟，然后在室温下温育 15 分钟到 2 小时。使用 Analyst GT 酶标仪测量每孔的发光值。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 人类三阴性乳腺癌移植瘤 MDA-MB-231 <b>Formulation:</b> PBS <b>Dosages:</b> 75 mg/kg <b>Administration:</b> 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。