

格尔德霉素；格尔德美素； Geldanamycin

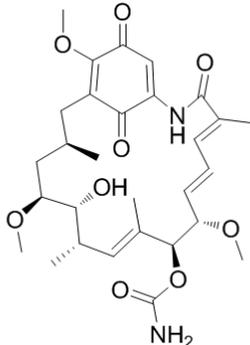
产品编号：MB5504

质量标准：>98%,BR

包装规格：1mg；5mg

产品形式：结晶性粉末

基本信息

分子式	C29H40N2O9	结构式	
分子量	560.6		
CAS No.	30562-34-6		
储存条件	2-8°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 36 mg/mL warmed		
	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：格尔德霉素 Geldanamycin 是 Hsp90 抑制剂，具有抗许多革兰氏阳性和一些革兰氏阴性细菌的活性。

别名：NSC 122750；2-Azabicyclo[16.3.1]docosa-4,6,10,18,21-pentaene-3,20,22-trione, 9,13-dihydroxy-8,14,19-trimethoxy-4,10,12,16-tetramethyl-, 9-carbamate (8CI)

物理性状及指标

外观：.....淡黄色结晶性粉末

溶解性：.....DMSO 36 mg/mL warmed；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

纯度：.....>98%

熔点：.....255°C

储存条件：2-8°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Geldanamycin 是一种天然的 HSP90 抑制剂， K_d 为 1.2 μ M，特异性干扰糖皮质激素受体 (GR) /HSP 联合。		
靶点	p185 (SKBr3 cells)	HSP90 (N-terminal domain) (Cell-free assay)	HSP90 (Cell-free assay)
	70 nM	0.78 μ M(Kd)	1.2 μ M(Kd)

体外研究	Geldanamycin 结合于 Hsp90s (残基 1-220) N-末端结构域的 ATP 结合位点。Geldanamycin 剂量依赖性抑制 Hsp90 的 ATPase 活性。在 A2780 人卵巢细胞系中，Geldanamycin 引起剂量依赖性 G2 期阻滞，并可逆抑制其进入 S 期。该抑制作用伴随 p53 的增加，最终证明是 p53 依赖性的。Geldanamycin 引起 p185 受体蛋白-酪氨酸激酶的泛素化和蛋白酶体降解，IC50 为 70 nM。Geldanamycin 是典型的抗肿瘤试剂，对一组 60 个人肿瘤细胞系的平均 GI50 为 0.18 μM。
体内研究	在 FRE/erbB-2 小鼠体内，Geldanamycin (50 mg/kg)对 p185-相关的磷酸酪氨酸水平表现出 30%的抑制。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂及各类抗生素请详询官网或客服)

MB4695	<u>NVP-BEP800</u>
MB5161	<u>PU-H71</u>
MB5150	<u>STA-9090;STA9090</u>
MB5602	<u>阿螺旋霉素</u>

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。格尔德霉素是来源吸水链霉菌 (Streptomyces Hygroscopicus) 的一种抗生素。格尔德霉素是一种强效的抗肿瘤抗生素。在纳摩尔浓度级对 60 个细胞系具有活性。特异性结合热休克蛋白 Hsp90 和它的内质网同源物 GP96，从而干扰了蛋白质的构象和细胞应激反应。此外，它还是一种强效的核激素受体家族抑制剂。

储液配置：

体 DMSO 质 浓度 积 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7837 mL	8.9184 mL	17.8368 mL
5 mM	0.3567 mL	1.7837 mL	3.5674 mL
10 mM	0.1784 mL	0.8918 mL	1.7837 mL
50 mM	0.0357 mL	0.1784 mL	0.3567 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验	核苷结合的等温滴定热法(ITC): 滴定实验使用 MSC 系统进行。在每个实验中，16 等份 15 μL geldanamycin (300 μM 在 1% DMSO 中)在 25 °C 下注射到 1.3 mL 蛋白质(31 μM 在 20 mMTris-HCl 中, pH 7.5, 1 mMEDTA)，得到的数据减去稀释热后进行拟合。将 geldanamycin 加入缓冲液和缓冲液加入蛋白质的稀释热在单独实验中测定。在核苷酸结合位点没有观察到 DMSO 的结合。滴定数据使用非线性最小二乘法曲线拟合算法拟合，该算法有三个不固定变量：化学计量，结合常数(K _b) 1/K _d) 和相互作用焓的变化(ΔH°)。Geldanamycin 结合到完整酵母 Hsp90 和 Hsp90 N-末端结构域，估计的解离常数分别为 1.22 μM 和 0.78 μM。结合到 C-末端片段时，没有观察到有意义的热量。
细胞实验	Cell lines: A2780 人卵巢癌细胞系 Concentrations: 0.001-10 μM Incubation Time: 3 小时 Method: 指数生长的细胞用 Geldanamycin 处理，不同时期的 DNA 合成通过溴脱氧尿苷

	(BrdUrd)的整合和流式细胞分析术评估。在此期间，处理的和未处理的细胞，总细胞数没有显著的差别。BrdUrd (10 μM)在 37 °C 下 4 小时的培育期间进行整合，将细胞采集并固定在 70%乙醇中。DNA 通过 2 N HCl 变性后，细胞用抗- BrdUrd 小鼠单克隆抗体培育，随后用异硫氰酸荧光素(FITC)-连接的山羊抗-小鼠 IgG 培育。细胞在室温下用碘化丙啶着色 30 分钟，使用 Coulter EPICS Profile 分析器通过流式细胞术分析。
动物实验	Animal Models: 负荷 FRE/erbB-2 肿瘤的 nu/nu 小鼠 Formulation: Geldanamycin 溶于 DMSO。 Dosages: 50 mg/kg Administration: 通过腹腔注射给药

【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 产品分类：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。