

17-DMAG ; 阿螺旋霉素

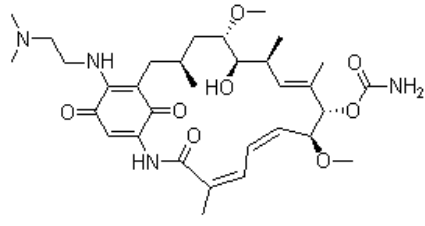
产品编号 : MB5602

质量标准 : HSP90 抑制剂, 进分

包装规格 : 25MG;100MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C32H48N4O8	结 构 式	
分子量	616.75		
CAS No.	467214-20-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	10 mM in DMSO		
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 : 阿螺旋霉素 Alvespimycin 是一种有效的 Hsp90 抑制剂。

别名 : 17-DMAG; NSC 707545

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :10 mM in DMSO

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Alvespimycin 是一种有效的 Hsp90 抑制剂, 结合到 Hsp90, EC ₅₀ 为 62 ± 29 nM。	
靶点	HSP90	GRP94
	62 nM (EC ₅₀)	65 nM (EC ₅₀)
体外研究	Alvespimycin 是 Hsp90 的有效抑制剂, 与 Hsp90 结合, EC ₅₀ 为 62 nM。 Alvespimycin (17-DMAG) 抑制过表达 Hsp90 客户蛋白 Her2 的人癌细胞系 SKBR3 和 SKOV3 的生长, 并导致 Her2 的下调以及与 Hsp90 抑制一致的 Hsp70 的诱导, 用于 Her2 降解, EC ₅₀ 为 SKBR3 和 SKOV3 细胞分别为 8±4 nM 和 46±24 nM;对于 Hsp70 诱导, 分别在 SKBR3 和 SKOV3 细胞中 EC ₅₀ 为 4±2nM 和 14±7nM。与载体对照相比,	

	Alvespimycin 剂量依赖性细胞凋亡（在 24 小时和 48 小时时间点平均 $P < 0.001$ ），浓度为 50nM 至 500nM，代表药理学可达到的剂量。与许多其他药物相似，Alvespimycin 也表现出慢性淋巴细胞白血病（CLL）细胞的时间依赖性细胞凋亡（ $P < 0.001$ ，平均所有剂量），并且暴露 24 至 48 小时。此外，Alvespimycin 在治疗 24 和 48 小时后比 17-AAG 更有效。
体内研究	在开始静脉注射前，肿瘤生长两个月，每四天一次，一个月内用 0、50、100 和 200 mg/kg 的二丙氨酰放射性醇或 0、5、10 和 20 mg/kg 的阿尔维斯平霉素。尽管样本不均一，但经 hsp90 抑制剂治疗的动物的肿瘤体积明显低于对照药物治疗的动物。HSP90 抑制剂已被证明在胃肠道癌动物模型中引起肝毒性。尽管如此，在 100 mg/kg 时，使用双甲酰氨嘧啶的肿瘤大小减小具有统计学意义，而在 10 或 20 mg/kg 时，使用阿尔维斯平霉素的肿瘤大小显著减小。

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)

MB4695	NVP-BEP800
MB5161	PU-H71
MB5150	STA-9090;STA9090

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。阿螺旋霉素 Alvespimycin 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 DMSO 质 量 浓度 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
	1 mM	1.6214 mL	8.1070 mL
5 mM	0.3243 mL	1.6214 mL	3.2428 mL
10 mM	0.1621 mL	0.8107 mL	1.6214 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作（来源于公开文献，仅供参考）

细胞实验	进行 MTT 测定以确定细胞毒性。将来自 CLL 患者的总共 1×10^6 个 CD19 选择的 B 细胞在 Alvespimycin, 17-AAG 或载体中孵育 24 或 48 小时。然后加入 MTT 试剂，并在分光光度测量之前将板再温育 24 小时。通过用膜联蛋白 V-荧光素异硫氰酸酯和碘化丙啶（PI）染色来测定细胞凋亡。暴露于药物后，用磷酸盐缓冲盐水洗涤细胞，并在 1 倍结合缓冲液中染色。通过流式细胞术评估细胞死亡。使用 System II 软件包分析数据。每个样品计数总共
------	--

	10000 个细胞。通过用亲脂性阳离子染料 JC-1 染色和通过流式细胞术分析来评估线粒体膜电位变化。
动物实验	老鼠 使用年轻雄性 CB-17 / IcrHsd-Prkdc-SCID 小鼠。通过在胶原溶液中每个移植体混合 1×10^5 BPH1 细胞和 2.5×10^5 CAF 制备重组异种移植体，使其凝胶化，用培养基覆盖并培养过夜。允许肿瘤形成超过 8 周，然后通过腹膜内注射化合物，用三种不同剂量的二棕榈酰 - 根赤壳素 (50,100 和 200mg / kg) 和 Alvepimycin (5,10 和 20mg / kg) 治疗 4 周。每四天用芝麻油。总共 12 周后，处死小鼠，切除肾脏，将移植体切成两半并拍照，然后进行组织学处理。测量移植体尺寸并使用该公式计算得到的肿瘤体积:体积=宽度×长度×深度× $\pi/6$ 。该公式代表了评估肿瘤体积的保守方法，因为它与较小的非侵入性肿瘤相比，低估了大量侵袭性肿瘤的体积。将切除的移植体固定在 10% 福尔马林中，包埋在石蜡中并加工用于免疫组织化学。

【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。