

## NVP-HSP990; HSP990

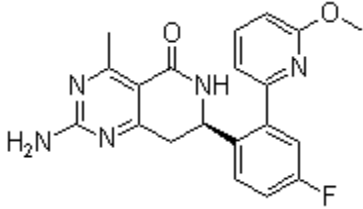
产品编号: MB7397

质量标准: >98%, Hsp90 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C20H18FN5O2	结 构 式	
分子量	379.39		
CAS No.	934343-74-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 75 mg/mL (197.68 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:** NVP-HSP990 是一种有效的, 选择性的 Hsp90 抑制剂。

**别名:** HSP-990; Pyrido[4,3-d]pyrimidin-5(6H)-one,

2-amino-7-[4-fluoro-2-(6-methoxy-2-pyridinyl)phenyl]-7,8-dihydro-4- methyl-, (7R)-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO 75 mg/mL (197.68 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

<b>产品描述</b>	NVP-HSP990 (HSP990) 是一种新型有效的选择性 HSP90 抑制剂, 对 HSP90 $\alpha$ / $\beta$ 的 IC50 分别为 0.6 nM 和 0.8 nM。	
<b>特性</b>	NVP-HSP990 是口服有效的 HSP90 抑制剂, 结构上与其他临床 HSP90 抑制剂不同。	
<b>靶点</b>	HSP90 $\alpha$ (Cell-free assay) 0.6 nM	HSP90 $\beta$ (Cell-free assay) 0.8 nM
<b>体外研究</b>	NVP-HSP990 基于 2-氨基-4-甲基-7,8-二氢吡啶[4,3-d]嘧啶-5(6H)-酮骨架, 其结构与其它已知的 HSP90 抑制剂不同。NVP-HSP990 与 HSP90 的 ATP 结合域 N 端结合。NVP-HSP990 对三个 HSP90 亚型(HSP90 $\alpha$ , HSP90 $\beta$ , 和 GRP94)具有单位数毫摩尔级的 IC50 值, 对第四个(TRAP-1)的 IC50 值为 320 nM, 其对不相关的酶, 受体和激酶具有选择性。NVP-HSP990 使 HSP90-p23	

	复合物游离, 耗尽客户蛋白 c-Met, 并诱导 c-Met 放大的 GTL-16 胃肿瘤细胞中的 Hsp70。NVP-HSP990 有效抑制人细胞系和各种类型初级肿瘤的生长。NVP-HSP990 显示出对 HSP90 客户蛋白的剂量和时间依赖性作用。NVP-HSP990 抑制所有 GIC 系胶质瘤肿瘤起始细胞(GIC)的增殖, IC50 值范围大约为 10 到 500 nM 之间。Olig2 是与细胞分化有关的功能标记, 并响应相关联的 NVP-HSP990, 在 Olig2 高的 GIC 系中, NVP-HSP990 减弱胞增殖。此外, NVP-HSP990 通过减少 CDK2 和 CDK4, 并增高凋亡相关的分子, 破坏细胞周期控制机制。
<b>体内研究</b>	NVP-HSP990 呈现出类似药物的制药和药理学性能, 具有较高的口服生物活性。在 GTL-16 异种移植模型中, 单一口服给药 15 毫克/千克 NVP-HSP990 诱导持续的 c-Met 下调和 Hsp70 上调。在重复剂量研究中, NVP-HSP990 处理导致 GTL-16 的肿瘤生长抑制, 也会对其他被明确的致癌 HSP90 客户蛋白驱动的人肿瘤移植模型产生生长抑制。

**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。NVP-HSP990 是一种有效的, 选择性的 **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		2.6358 mL	13.1791 mL	26.3581 mL
5 mM		0.5272 mL	2.6358 mL	5.2716 mL
10 mM		0.2636 mL	1.3179 mL	2.6358 mL
50 mM		0.0527 mL	0.2636 mL	0.5272 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	HSP90 结合, ATPase, 和选择性试验: HSP90 对 HSP90 $\alpha$ , SP90 $\beta$ , 和 Grp94 的抑制效能通过 AlphaScreen 竞争试验测定, 对 TRAP-1 的活性通过 ATPase 试验测定。
<b>细胞实验</b>	Cell lines: GICs Concentrations: ~1 $\mu$ M Incubation Time: 7 天 Method: 解离的 GICs 以 10 个细胞/微升接种于 6 孔板, 并用不同浓度的 NVP-HSP990 培养 7 天。形成的肿瘤群解离为单个细胞, 并使用 0.2% 的台盼蓝排除血细胞计数器计数。
<b>动物实验</b>	Animal Models: GTL-16, NCI-H1975, BT474, 和 MV4;11 肿瘤异种移植裸鼠或 SCID 小鼠模型 Formulation: 100% 聚乙二醇 polyethylene glycol (PEG400)

Dosages: 15 毫克/千克  
Administration: 口服

**【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。