

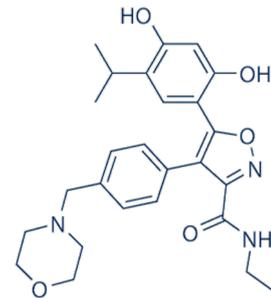
AUY922 (HSP抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC8006-10mM	AUY922 (HSP抑制剂)	10mM×0.2ml
SC8006-5mg	AUY922 (HSP抑制剂)	5mg
SC8006-25mg	AUY922 (HSP抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(5Z)-N-ethyl-5-(4-hydroxy-6-oxo-3-propan-2-ylcyclohexa-2,4-dien-1-ylidene)-4-[4-(morpholin-4-ylmethyl)phenyl]-2H-1,2-oxazole-3-carboxamide
简称	AUY922
别名	NVP-AUY922, VER 52296, VER-52296, VER52296
中文名	N/A
化学式	C ₂₆ H ₃₁ N ₃ O ₅
分子量	465.54
CAS号	747412-49-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 93mg/ml warming; Ethanol 31mg/ml
溶液配制	5mg加入1.07ml DMSO, 或每4.66mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC8006-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Luminespib (AUY-922, NVP-AUY922)是一种高效的HSP90抑制剂, 无细胞试验中作用于HSP90α/β的IC50为13nM/21nM, 对HSP90家族成员GRP94和TRAP-1具有稍弱的作用, 与任何小分子HSP90配体均可紧密结合。Phase 2。				
信号通路	Cytoskeletal Signaling; Metabolism				
靶点	HSP90α	HSP90β	—	—	—
IC50	13nM	21nM	—	—	—
体外研究	体外研究时NVP-AUY922抑制多种人类肿瘤细胞系的增殖, GI50平均值为9nM。NVP-AUY922作用于胃癌细胞时IC50值为2到40nM。NVP-AUY922作用于BEAS-2B细胞IC50为28.49nM。使用NVP-AUY922时不影响HSP90的表达, 但是提高HSP70的表达。NVP-AUY922增强HSP70与HSP90的结合能力。NVP-AUY922造成p23与HSP复合体的分离。NVP-AUY922能使HSP70结合到HSP90复合体。使用NVP-AUY922, 引起酪氨酸激酶受体如VEGFR1、2、3和PDGFR-α的表达下降, Akt和p-Akt也下降。另外, NVP-AUY922作用于NCI-N87细胞, 引起HER2表达下降。NVP-AUY922提高HSP90与目标蛋白的结合力, 然后通过蛋白酶使蛋白降解。NVP-AUY922可以改变多条信号通路而影响细胞生长。此外, 使用蛋白酶抑制剂MG132, 恢复由于使用NVP-AUY922而降低的胸核苷酸合酶的重新表达。NVP-AUY922提高cleaved caspase-3的表达及导致HSC-2细胞凋亡。				
体内研究	使用NVP-AUY922可引起强的抗癌反应, 可抑制HSC-2移植瘤模型中p-Akt和VEGF的表达。在12种实验肿瘤中观察到5种肿瘤衰退。体重降低<5%, 且与HSP90相关的生物标志明显改变。BT474中, ERBB2完全缺失, ERα耗尽, 且CDK4和磷酸化ERK1/2降低。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	NVP-AUY922溶解在DMSO中, 浓度为10mM。通过作用于HSP90α、HSP90β、GRP94、TRAP-1、HSP72和拓扑异构酶II评估NVP-AUY922的活性。

细胞实验	
细胞系	人类胃癌细胞系NCI-N87
浓度	1 μ M
处理时间	3天
方法	人类胃癌细胞NCI-N87按 $5-7 \times 10^3$ 密度接种在96孔板中，每孔接种50 μ l，在37 $^{\circ}$ C下温育24小时，然后用NVP-AUY922处理1到3天。实验处理后，使用MTT实验测细胞活力，用酶标仪分析。

动物实验	
动物模型	携带WM266.4人类黑色素移植瘤的雌性NCr无胸腺鼠
配制	溶于在DMSO中，用无菌盐水/Tween-20稀释。
剂量	50mg/kg
给药方式	静脉注射或腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Lee KH, et al. Cancer Sci, 2011, 102(7), 1388-1395.
- 2.Okui T, et al. Anticancer Res, 2011, 31(4), 1197-1204.
- 3.Eccles SA, et al. Cancer Res, 2008, 68(8), 2850-2860.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC8006-10mM	AUY922 (HSP抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC8006-5mg	AUY922 (HSP抑制剂)	5mg
SC8006-25mg	AUY922 (HSP抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制成高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01