

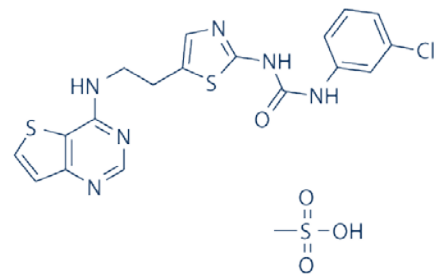
SNS-314 Mesylate (Aurora A抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0119-10mM	SNS-314 Mesylate (Aurora A 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0119-5mg	SNS-314 Mesylate (Aurora A 抑制剂)	5mg
SC0119-25mg	SNS-314 Mesylate (Aurora A 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-(3-chlorophenyl)-3-[5-[2-(thieno[3,2-d]pyrimidin-4-ylamino)ethyl]-1,3-thiazol-2-yl]urea;methanesulfonic acid
简称	SNS-314 Mesylate
别名	SNS-314, SNS 314, SNS314
中文名	N/A
化学式	C ₁₈ H ₁₅ ClN ₆ OS ₂ .CH ₄ O ₃ S
分子量	527.04
CAS号	1146618-41-8
纯度	94.0%
溶剂/溶解度	Water 6mg/ml; DMSO 105mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.95ml DMSO, 或者每5.27mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0119-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	SNS-314 Mesylate是一种有效的, 选择性的Aurora A、Aurora B和Aurora C抑制剂, IC50分别为9nM、31nM和3nM, 对Trk A/B、Flt4、Fms、Axl、c-Raf和DDR2作用效果稍弱。Phase 1。				
信号通路	Cell Cycle				
靶点	Aurora C	Aurora A	Aurora B	—	—
IC50	3nM	9nM	31nM	—	—
体外研究	SNS-314有效抑制肿瘤细胞系, IC50为1.8到24nM, 不依赖于细胞的相对Aurora-A或Aurora-B蛋白水平。SNS-314抑制组蛋白H3在Ser10位点磷酸化作用, 使HCT116细胞有丝分裂紊乱。连续用SNS-314和Carboplatin、Gemcitabine、5-FU、Daunomycin和SN-38处理显示出加强的抗增殖效果, SNS-314和Gemcitabine、Docetaxel或Vincristine联用显示出协同效应。				
体内研究	SNS-314作用于HCT116结肠移植瘤, 显示出明显和持久的抗癌效果。170mg/kg剂量的SNS-314处理人类乳腺癌(MDA-MB-231)、前列腺癌(PC-3)、肺癌(H1299和Calu-6)、卵巢癌(A2780)及恶性黑色素瘤(A375)的鼠移植瘤也显示出明显的抗癌活性, 肿瘤生长抑制率为54到91%。				
临床实验	N/A				
特征	SNS-314是Sunesis的领先候选产品。				

➤ 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	加入SNS-314, 使用同质时间分辨荧光(HTRF)测定Aurora三种亚型A、B和C的激酶活性。使用生物素结合的组蛋白H3肽段作为底物。Aurora-A激酶(7.5nM)在10mM Tris-HCl pH为7.2、10mM MgCl ₂ 、0.1% BSA、0.05% Tween® 20、1mM DTT、120nM生物素肽段ARTKQTARKSTGG-KAPRKQLA-GGK-生物素及6μM ATP的混合物中25°C环境下反应1小时。加入200mM EDTA终止反应。5nM Aurora-B和Aurora-C、120nM生物素肽和300μM ATP在25°C下反应1小时。为了测定组蛋白H3的磷酸化, 0.2ng/ml钬结合的抗磷酸化组蛋白H3抗体和8nM链霉亲和素-XL665在25°C下温育45分钟。使用Analyst®AD测定产品。在330-370nm处测定钬结合的抗体的抗体。在620和665nm处分别测定穴状化合物和荧光共振能量转移(FRET) 释放物。使用GraphPad Prism获得IC50曲线和IC50值。

细胞实验	
细胞系	人类结肠直肠(HCT116, HT29)、肺(Calu-6, H1299)、前列腺(PC-3)、卵巢(A2780)、乳腺(MDA-MB-231)、子宫(HeLa)、胰脏(MIA PaCa-2)及恶性黑色素瘤(A375)细胞系。
浓度	10 ⁻⁶ 到1μM
处理时间	96小时
方法	细胞和各种浓度SNS-314一起温育96小时后, 加入BrdU在37°C下再温育2小时。测定BrdU的合并率。在SpectraMax Gemini XS计数板上测定化学荧光。通过实验值(SNS-314处理)与对照值(DMSO处理)之比百分数测定细胞增殖。

动物实验	
动物模型	携带HCT116、MDA-MB-231、PC-3、H1299、Calu-6和A2780移植瘤的雌鼠
配制	20% Captisol®(磺基丁基醚β-环式糊精)。
剂量	25.5到170mg/kg
给药方式	腹腔注射

参考文献:

1. Oslob JD, et al. Bioorg Med Chem Lett. 2008; 18(17):4880-4884.
2. VanderPorten EC, et al. Mol Cancer Ther. 2009; 8(4):930-939.
3. Arbitrario JP, et al. Cancer Chemother Pharmacol. 2010; 65(4):707-717.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0119-10mM	SNS-314 Mesylate (Aurora A抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0119-5mg	SNS-314 Mesylate (Aurora A抑制剂)	5mg
SC0119-25mg	SNS-314 Mesylate (Aurora A抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品对人体有刺激性, 操作时请小心, 并注意适当防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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降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、体内研究结果或其它相关文献, 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>

使用本产品的文献:

1. Wang LL, Jin XH, Cai MY, Li HG, Chen JW, Wang FW, Wang CY, Hu WW, Liu F, Xie D . AGBL2 promotes cancer cell growth through IRGM-regulated autophagy and enhanced Aurora A activity in hepatocellular carcinoma. Cancer Lett. 2018 Feb 1 414:71-80.

Version 2024.03.12