

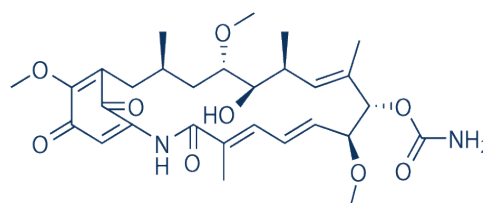
Geldanamycin (HSP90抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|-------------------------|------------|
| SC0191-10mM | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC0191-5mg | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 5mg |
| SC0191-25mg | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|--|
| 化学名 | [(3R,5S,6R,7S,8E,10S,11S,12Z,14E)-6-hydroxy-5,11,21-trimethoxy-3,7,9,15-tetramethyl-16,20,22-trioxo-17-azabicyclo[16.3.1]docosa-1(21),8,12,14,18-pentaen-10-yl]carbamate |
| 简称 | Geldanamycin |
| 别名 | Geldanomycin |
| 中文名 | 格尔德霉素 |
| 化学式 | C ₂₉ H ₄₀ N ₂ O ₉ |
| 分子量 | 560.64 |
| CAS号 | 30562-34-6 |
| 纯度 | 99.0% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 50mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入0.89ml DMSO, 或每5.61mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0191-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------|---|--------------------------|-----------|---|---|
| 产品描述 | Geldanamycin是一种天然的HSP90抑制剂, Kd为1.2μM, 特异性干扰糖皮质激素受体(GR)/HSP联合。 | | | | |
| 信号通路 | Cytoskeletal Signaling; Metabolism | | | | |
| 靶点 | p185 | HSP90(N-terminal domain) | HSP90 | — | — |
| IC50 | 70nM | 0.78μM(Kd) | 1.2μM(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70nM。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0.18μM。 | | | | |
| 体内研究 | 在FRE/erbB-2小鼠体内, Geldanamycin(50mg/kg)对p185-相关的磷酸酪氨酸水平表现出30%的抑制。 | | | | |
| 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 | ATPase测定基于再生酶偶联法进行, 其中ADP通过磷酸烯醇丙酮酸盐被丙酮酸激酶磷酸化, 与产生的丙酮酸盐通过NADH被乳酸脱氢酶减少相耦合。 |

| 细胞实验 | |
|------|--------------|
| 细胞系 | A2780人卵巢癌细胞系 |
| 浓度 | 0.001-10μM |
| 处理时间 | 3小时 |

| | |
|----|--|
| 方法 | 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 μ M)在37 $^{\circ}$ 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2N 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 | |
|------|------------------------|
| 动物模型 | 负荷FRE/erbB-2肿瘤的nu/nu小鼠 |
| 配制 | Geldanamycin溶于DMSO。 |
| 剂量 | 50mg/kg |
| 给药方式 | 通过腹腔注射给药 |

参考文献:

1. Miller P, et al. Cancer Res. 1994; 54(10):2724-2730.
2. Supko JG, et al. Cancer Chemother Pharmacol. 1995; 36(4):305-315.
3. Schnur RC, et al. J Med Chem. 1995; 38(19):3806-3812.
4. McIlwrath AJ, et al. Cancer Chemother Pharmacol. 1996; 37(5):423-428.
5. Mimnaugh EG, et al. J Biol Chem. 1996; 271(37):22796-22801.
6. Roe SM, et al, J Med Chem. 1999; 42(2):260-266.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|-------------------------|---------------------|
| SC0191-10mM | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 10mM \times 0.2ml |
| SC0191-5mg | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 5mg |
| SC0191-25mg | Geldanamycin (HSP90抑制剂) | 25mg |
| — | 说明书 | 1份 |

保存条件:

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

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效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>

Version 2017.02.09