



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **SNX-2112 (PF-04928473)**

CAS 号: **908112-43-6**

产品货号: **S78368**

生物活性:

Description	SNX-2112 (PF 04928473) 是一种可口服的 Hsp90 抑制剂, Kd 值为 16 nM, 对 Hsp90 α 和 Hsp90 β 的 IC50 值均为 30 nM; 同时可诱导 Her-2 的降解, 抑制 Grp94 和 Trap-1 的活性, IC50 值分别为 10 nM, 4.275 μ M 和 0.862 μ M。SNX-2112 (PF 04928473) 结合 Hsp90 亚型 Hsp90 α , Hsp90 β 和 Hsp90b1/Grp94, Kd 分别为 4 nM, 6 nM 和 484 nM。			
IC50 & Target[1]	HSP90 α 30 nM (IC ₅₀)	HSP90 β 30 nM (IC ₅₀)	GRP94 4275 nM (IC ₅₀)	TRAP-1 862 nM (IC ₅₀)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	A-375	IC ₅₀	1 nM	Inhibition of Hsp90 in human A375 cells assessed as pS6 degradation after 24 hrs by high content screening
	A-375	IC ₅₀	2 nM	Inhibition of Hsp90 in human A375 cells assessed as Hsp70 induction after 24 hrs by high content screening
	A-375	IC ₅₀	23 nM	Antiproliferative activity against human A375 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	AU565	IC ₅₀	10 μ M	Inhibition of Hsp90 in human AU565 cells assessed as Her2 degradation after 24 hrs by high content screening
	AU565	IC ₅₀	41 nM	Inhibition of Hsp90 in human AU565 cells assessed as pERK degradation after 24 hrs by high content screening
	HCT-15	IC ₅₀	52 nM	Antiproliferative activity against human HCT15 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	HT-29	IC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human HT-29 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	J774.A1	IC ₅₀	< 0.06 μ M	Cytotoxicity against mouse J774.A1 cells after 72 hrs by MTS assay
	K562	IC ₅₀	6 nM	Antiproliferative activity against human K562 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	LNCaP	IC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human LNCAP cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	MCF7	IC ₅₀	53 nM	Antiproliferative activity against human MCF7 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	MDA-MB-231	IC ₅₀	6 nM	Antiproliferative activity against human MDA-MB-231 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	MRC5	CC ₅₀	21.34 μ M	Cytotoxicity against human MRC5 cells after 48 hrs by MTT assay
	NCI-H460	IC ₅₀	18 nM	Antiproliferative activity against human NCI-H460 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	PC-3	IC ₅₀	17 nM	Antiproliferative activity against human PC3 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	SK-MEL-5	IC ₅₀	6 nM	Antiproliferative activity against human SK-MEL-5 cells after 72



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

				to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	SW-620	IC ₅₀	3 nM	Antiproliferative activity against human SW620 cells after 72 to 144 hrs by cyquant DNA dye method
	Vero	EC ₅₀	1.85 μM	Antiviral activity against HSV2 strain 333 infected in african green monkey Vero cells assessed as inhibition of cytopathic effect after 48 hrs by plaque reduction assay
	Vero	CC ₅₀	13.33 μM	Cytotoxicity against african green monkey Vero cells assessed as inhibition of cell viability after 48 hrs by MTT assay
	Vero	EC ₅₀	2.26 μM	Antiviral activity against HSV1 strain F ATCC VR733 infected in african green monkey Vero cells assessed as inhibition of cytopathic effect after 48 hrs by plaque reduction assay
In Vitro	SNX-2112 是一种口服有效的 Hsp90 抑制剂, Kd 值为 16 nM, 同时还能诱导 Her-2 降解, IC50 值为 10 nM[3]。 SNX-2112 与 Hsp90 结合, 对 Hsp90 α 和 β、Grp94 和 Trap-1 的 IC50 分别为 30 nM、30 nM、4.275 μM 和 0.862 μM[1]。 SNX-2112 对多种癌细胞类型均表现出强效的抗增殖活性, IC50 值为 3 nM 至 53 nM。SNX-2112 对 AU565 细胞中的 Her2 和 p-ERK 以及 A375 细胞中的 p-S6 表现出强效作用, IC50 分别为 11 nM、41 nM 和 1 nM。SNX-2112 还能诱导 A375 细胞中的 Hsp70, IC50 为 2 nM[3]。 此外, SNX-2112 还能有效阻断不同细胞中 Hsp90 受体 (例如 Akt、ERK 和 NF-κB 通路)的信号传导。SNX-2112 可抑制多发性骨髓瘤 (MM) 细胞生长, 包括 MM.1S、U266、INA-6、RPMI8226、OPM1、OPM2、MM.1R 和 Dox40 MM 细胞系, 48 小时时的 IC50 分别为 52、55、19、186、89、67、93 和 53 nM。SNX-2112 (2.5-10 nM) 还能抑制破骨细胞的形成, 这与 ERK/c-fos 和 PU.1 的下调有关[4]。			
Solvent&Solubility	细胞实验:			
	DMSO 中的溶解度 : 25 mg/mL (53.82 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.1529 mL	10.7647 mL
		5 mM	0.4306 mL	2.1529 mL
		10 mM	0.2153 mL	1.0765 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一			



	请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水电溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.38 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。
参考文献	[1]. Chandarlapaty S, et al. SNX2112, a synthetic heat shock protein 90 inhibitor, has potent antitumor activity against HER kinase-dependent cancers. Clin Cancer Res. 2008 Jan 1;14(1):240-8. [2]. Mishra SJ, et al. Transformation of the Non-Selective Aminocyclohexanol-Based Hsp90 Inhibitor into a Grp94-Selective Scaffold. ACS Chem Biol. 2017 Jan 20;12(1):244-253. [3]. Huang KH, et al. Discovery of novel 2-aminobenzamide inhibitors of heat shock protein 90 as potent, selective and orally active antitumor agents. J Med Chem. 2009 Jul 23;52(14):4288-305 [4]. Okawa Y, et al. SNX-2112, a selective Hsp90 inhibitor, potently inhibits tumor cell growth, angiogenesis, and osteoclastogenesis in multiple myeloma and other hematologic tumors by abrogating signaling via Akt and ERK. Blood. 2009 Jan 22;113(4):846-55.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80℃, 6 months; -20℃, 1 month。 -80℃ 储存时，请在 6 个月内使用， -20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1529 mL	10.7647 mL	21.5295 mL	53.8236 mL
	5 mM	0.4306 mL	2.1529 mL	4.3059 mL	10.7647 mL
	10 mM	0.2153 mL	1.0765 mL	2.1529 mL	5.3824 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

	15 mM	0.1435 mL	0.7176 mL	1.4353 mL	3.5882 mL
	20 mM	0.1076 mL	0.5382 mL	1.0765 mL	2.6912 mL
	25 mM	0.0861 mL	0.4306 mL	0.8612 mL	2.1529 mL
	30 mM	0.0718 mL	0.3588 mL	0.7176 mL	1.7941 mL
	40 mM	0.0538 mL	0.2691 mL	0.5382 mL	1.3456 mL
	50 mM	0.0431 mL	0.2153 mL	0.4306 mL	1.0765 mL



源叶