



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: **NMS-E973**
CAS 号: **1253584-84-7**
产品货号: **S89712**

生物活性:					
Description	NMS-E973 is a potent and selective inhibitor of HSP90. NMS-E973 binds to the ATP binding site of Hsp90α with a DC50 of <10 nM. NMS-E973 is able to cross the blood-brain barrier (BBB). Antitumor efficacy[1].				
IC50 & Target	HSP90α 10 nM (DC50)				
In Vitro	NMS-E973 inhibits cancer cell proliferation. NMS-E973 shows a widespread antiproliferative activity, with an average IC50 of 1.6 μM and 15 cell lines with an IC50 <100 nM[1].				
	Cell Proliferation Assay[1]				
	Cell Line:	Carcinoma breast DU-4475, EVSA-T, CAL-51, HCC1954, BT-474, HCC1419, HDQ-P1 cells; Leukemia MV-4-11 and MOLM-13 cells; Melanoma A-375 cells			
	Concentration:				
	Incubation Time:	24, 48, 72 hours			
In Vivo	Result:	IC50s of 13, 16, 56, 61, 73, 76, and 89 nM for DU-4475, EVSA-T, CAL-51, HCC1954, BT-474, HCC1419, HDQ-P1 cells, respectively. IC50s of 29 and 35 nM for MV-4-11, MOLM-13 cells, respectively. The IC50 of 133 nM for A-375 cell.			
	NMS-E973 (60 mg/kg; i.v.) inhibits the growth of A375 tumors subcutaneously or intracranially implanted in mice[1].				
	NMS-E973 exhibits moderate elimination half-lives (5.55±1.07 h) due to high plasma clearance (39.9±1.70 mL/min/kg) combined with large volumes of distribution (5.83±3.18 L/kg) following intravenous administration (10 mg/kg) in mice[1].				
	Animal Model:	Balb/c male nude mice (aged 6 to 8 weeks) xenografted with the A375 tumors[1]			
	Dosage:	60 mg/kg			
In Vivo	Administration:	Administered twice daily i.v. according to 2 schedules: (i) every other day for 12 days and (ii) 3 days on/1 day off/3 days on (3-1-3, one cycle).			
	Result:	Both schedules resulted in tumor shrinkage and TGI of 74% and 89%, respectively.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (110.03 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	10 mg
		1 mM	2.2006 mL	11.0028 mL	22.0056 mL
		5 mM	0.4401 mL	2.2006 mL	4.4011 mL
10 mM		0.2201 mL	1.1003 mL	2.2006 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℃, 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。 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 依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.50 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 ddH₂ O 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 (5.50 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 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 生理盐水水溶液 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。
参考文献	[1]. Gianpaolo Fogliatto, et al. NMS-E973, a novel synthetic inhibitor of Hsp90 with activity against multiple models of drug resistance to targeted agents, including intracranial metastases. Clin Cancer Res. 2013 Jul 1;19(13):3520-32.

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	2.2006 mL	11.0028 mL	22.0056 mL	55.0140 mL
	5 mM	0.4401 mL	2.2006 mL	4.4011 mL	11.0028 mL
	10 mM	0.2201 mL	1.1003 mL	2.2006 mL	5.5014 mL
	15 mM	0.1467 mL	0.7335 mL	1.4670 mL	3.6676 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

	20 mM	0.1100 mL	0.5501 mL	1.1003 mL	2.7507 mL
	25 mM	0.0880 mL	0.4401 mL	0.8802 mL	2.2006 mL
	30 mM	0.0734 mL	0.3668 mL	0.7335 mL	1.8338 mL
	40 mM	0.0550 mL	0.2751 mL	0.5501 mL	1.3753 mL
	50 mM	0.0440 mL	0.2201 mL	0.4401 mL	1.1003 mL
	60 mM	0.0367 mL	0.1834 mL	0.3668 mL	0.9169 mL
	80 mM	0.0275 mL	0.1375 mL	0.2751 mL	0.6877 mL
	100 mM	0.0220 mL	0.1100 mL	0.2201 mL	0.5501 mL



源叶