

HB181130

SNS-314 Mesylate

产品信息

| 产品名称 | 产品编号 | 规格 |
|------------------|-----------|-------|
| SNS-314 Mesylate | 51104ES08 | 5 mg |
| SNS-314 Mesylate | 51104ES25 | 25 mg |

产品描述

SNS-314 Mesylate 是一种 ATP 竞争性、选择性、强效 Aurora kinase 抑制剂, 作用于 Aurora A, Aurora B 和 Aurora C, IC₅₀ 分别为 9 nM, 31 nM 和 3 nM。SNS-314 对多种人癌细胞具有广泛的抑制增殖作用, IC₅₀ 为 1.8 nM-24 nM, 并抑制组蛋白 H3 磷酸化 (Ser 10)。在多种人移植瘤小鼠模型中, SNS-314 也表现出抗肿瘤活性, 抑制肿瘤生长, 包括 PC-3、H1299、A2780、MDA-MB-231 和 A375。

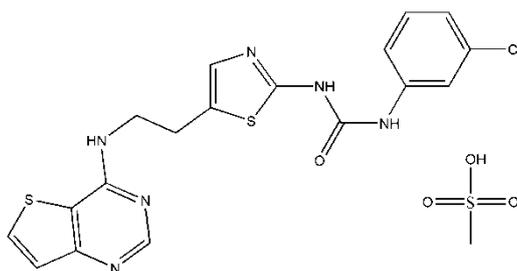
目前, SNS-314 Mesylate 已进入临床 Phase 1 阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

| | |
|-------------------------|--|
| 化学名 (Chemical Name) | 1-(3-chlorophenyl)-3-[5-[2-(thieno[3,2-d]pyrimidin-4-ylamino)ethyl]-1,3-thiazol-2-yl]urea; methanesulfonic acid |
| 靶点 (Target) | Aurora A, Aurora B, Aurora C |
| CAS 号 (CAS NO.) | 1146618-41-8 |
| 分子式 (Molecular Formula) | C ₁₈ H ₁₅ ClN ₆ OS ₂ •CH ₄ O ₃ S |
| 分子量 (Molecular Weight) | 527.04 |
| 外观 (Appearance) | 白色粉末 |
| 纯度 (Purity) | ≥95% |
| 溶解性 (Solubility) | 溶于 DMSO |

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于 -20 ℃, 有效期 2 年。易溶于 DMSO。建议分装后 -20 ℃ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验

为研究 SNS-314 对 HCT116 结肠癌细胞的作用，用不同浓度 SNS-314（4-63 nM）处理细胞 8、16、24h，发现不同浓度处理 8h 时，SNS-314 明显降低 HCT116 细胞无性克隆形成，随浓度增加，抑制作用增强。随后在软琼脂克隆形成实验中，用不同浓度 SNS-314（4-250 nM）处理 HCT116 细胞 24h，随浓度增加，HCT116 细胞无性克隆被完全抑制。^[2]

（二）动物实验

建立 HCT116 结肠癌移植瘤模型，给小鼠腹腔注射 125 mg/kg SNS-314（每周 1 次，3 次）（qw），150 mg/kg（每周 2 次，3 次）（biw），100 mg/kg（每天 1 次，持续 5 天，间隔 9 天，再连续 5 天）（qd×5, 9d off）。与对照组相比，通过 3 种给药方式，SNS-314 都可以达到显著抑制肿瘤生长的效果，其中，每日剂量最有效的是 qd×5, 9d off 给药，而最有效间隔剂量是 qw 和 biw 给药。^[2]

参考文献

- [1] Oslob JD, et al. Discovery of a potent and selective aurora kinase inhibitor. *Bioorg Med Chem Lett*, 18(17): 4880-4884(2008).
- [2] Arbitrario J P, et al. SNS-314, a pan-Aurora kinase inhibitor, shows potent anti-tumor activity and dosing flexibility in vivo. *Cancer chemotherapy and pharmacology*, 65(4): 707-717(2010).
- [3] VanderPorten EC, et al. The Aurora kinase inhibitor SNS-314 shows broad therapeutic potential with chemotherapeutics and synergy with microtubule-targeted agents in a colon carcinoma model. *Mol Cancer Ther* 8(4):930-939(2009).