

HB181204

SNX-2112

产品信息

产品名称	产品编号	规格
SNX-2112	51206ES08	5mg
SNX-2112	51206ES25	25mg

产品描述

SNX-2112 是一种新型 HSP90 抑制剂, 竞争性结合到 HSP90 的 N 端 ATP 结合袋中, 具有高效口服生物活性, 其前体药物为 SNX-5422, 高效作用于多种癌细胞。SNX-5422 快速转化为 SNX-2112, 在肿瘤组织中聚集从而发挥作用。SNX-2112 抑制多发性骨髓瘤(MM)及其他血液类肿瘤, 其活性比 17-AGG 更高, 而且, SNX-2112 抑制移植瘤小鼠模型中 MM 细胞生长, 并延长存活时间。SNX-2112 显著诱导多种癌细胞的细胞自噬和细胞凋亡。

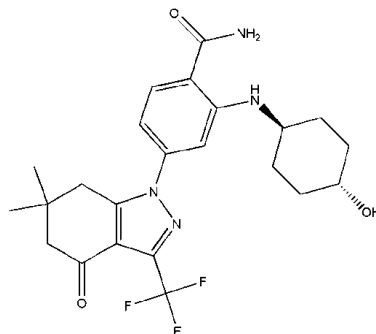
目前, SNX-2112 已进入临床 Phase 1 研究阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	PF-04928473
化学名 (Chemical Name)	4-(6,6-dimethyl-4-oxo-3-(trifluoromethyl)-4,5,6,7-tetrahydroindazol-1-yl)-2-((1r,4r)-4-hydroxycyclohexylamino)benzamide
靶点 (Target)	HSP90
CAS 号 (CAS NO.)	908112-43-6
分子式 (Molecular Formula)	C ₂₃ H ₂₇ F ₃ N ₄ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	464.48
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
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（体外研究）

- 1) 为检测 SNX-2112 对肿瘤细胞的作用，以乳腺癌细胞、肺癌细胞及卵巢癌细胞等为研究对象，SNX-2112 抑制癌细胞增殖，IC₅₀ 范围为 10-50 nM。^[1]
- 2) 为检测 SNX-2112 对 MM 细胞的作用，MTT 结果表明，SNX-2112 抑制多种 MM 细胞生长，包括 MM.1S, U266, INA-6, RPMI8226, OPM1, OPM2, MM.1R, 和 Dox40, IC₅₀ (48 h) 分别为 52, 55, 19, 186, 89, 67, 93, 和 53 nM。分别用不同浓度的 SNX-2112 (60nM、125nM、250nM) 处理 MM.1S, U266, OPM1 细胞 48h, 发现细胞凋亡率明显提高。^[3]

（二）动物实验（体内研究）

- 1) 通过建立 BT-474 乳腺癌移植瘤模型，研究 SNX-2112 在动物体内的作用，用 100mg/kg SNX-5542 (SNX-2112 的前体药) 或更高剂量 SNX-5542 (周一、三、五分别 150 mg/kg、200 mg/kg) 处理小鼠模型，SNX-5542 均可以达到完全的抑制肿瘤生长作用。SNX-5542 (50 mg/kg, 每周五次) 也可以引起完全的肿瘤生长抑制和部分 BT-474 移植瘤衰退。^[1]
- 2) 为检测 SNX-2112 在动物体内的作用，分别给 MM.1S 移植瘤小鼠口服 20、40mg/kg SNX-5542 (SNX-2112 的前体药) (每周 3 次，共维持 3 周)，与对照组相比，SNX-5542 显著抑制 MM 肿瘤生长。^[3]

参考文献

- [1] Chandralapaty S, et al. SNX2112, a synthetic heat shock protein 90 inhibitor, has potent antitumor activity against HER kinase-dependent cancers. *Clin cancer Res* 14(1): 240-248 (2008).
- [2] Liu KS, et al. SNX-2112, an Hsp90 inhibitor, induces apoptosis and autophagy via degradation of Hsp90 client proteins in human melanoma A-375 cells. *Cancer Letters*. 318: 180-188 (2012).
- [3] Yutaka Okawa, 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*. 113(4): 846-855 (2009).
- [4] Chinn DC, et al. Anti-Tumor Activity of the HSP90 Inhibitor SNX-2112 in Pediatric Cancer Cell Lines. *Pediatr Blood Cancer* 58: 885-890 (2012).
- [5] Thomas BH, et al. Antitumor activity of SNX-2112, a synthetic heat shock protein-90 inhibitor, in MET-amplified tumor cells with or without resistance to selective MET inhibition. *Clin Cancer Res*. 17(1): 122-133 (2011).