

HB181205

## Ispinesib 伊斯平斯

### 产品信息

产品名称	产品编号	规格
Ispinesib 伊斯平斯	51304ES10	10 mg
Ispinesib 伊斯平斯	51304ES50	50 mg

### 产品描述

Ispinesib (伊斯平斯, 又称 SB-715992, CK-0238273) 是第一个 KSP 小分子抑制剂, 是一种有效的、特异性、变构性抑制剂。Ispinesib 改变 KSP 与微管蛋白 (microtubules) 的结合, 通过阻止 ADP 释放而不改变微管中 KSP-ADP 复合体的释放, 从而抑制 KSP 的运动。Ispinesib 抑制多种癌细胞增殖, 诱导细胞凋亡, 并导致体内肿瘤衰退。当 Ispinesib 与 genistein 联合使用时, 具有更强的生长抑制作用和细胞凋亡诱导活性, Ispinesib 还可以提高 trastuzumab、lapatinib、doxorubicin 和 capecitabine 的抗肿瘤活性。

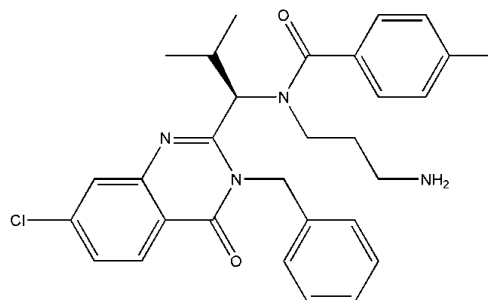
目前, Ispinesib 已处于临床 Phase 2 研究阶段。

**【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)	SB-715992, CK-0238273
化学名 (Chemical Name)	(R)-N-(3-aminopropyl)-N-(1-(3-benzyl-7-chloro-4-oxo-3,4-dihydroquinazolin-2-yl)-2-methylpropyl)-4-methylbenzamide
靶点 (Target)	Kinesin Spindle Protein (KSP)
CAS 号 (CAS NO.)	336113-53-2
分子式 (Molecular Formula)	C <sub>30</sub> H <sub>33</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>2</sub>
分子量 (Molecular Weight)	517.06
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (100mg/ml)、乙醇 (100mg/ml)

### 结构式 (Structure)



### 运输与保存方法

粉末直接保存于 -20 °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO、乙醇。建议分装后 -20 °C 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) 为研究 Ispinesib 对 PC-3 前列腺癌细胞的作用, 用 15 和 30 nM Ispinesib 孵育细胞, MTT 结果显示 Ispinesib 抑制 PC-3 细胞生长, 其作用方式为时间和剂量依赖型, 72h 后, Ispinesib 抑制细胞生长的作用显著提高, 分别为 48.65% (15 nM) 和 52.16% (30 nM)。<sup>[2]</sup>

2) 为检测 Ispinesib 对乳腺癌细胞的作用, 用不同浓度的 Ispinesib 孵育 50 多种人乳腺癌细胞,  $GI_{50}$  范围为 7.4-600 nM。150 nM Ispinesib 孵育 MDA-MB-468 和 BT-474 两类细胞, 处理 16h 后, 2 种细胞中有丝分裂细胞达到最大程度聚集; 而 48h 后, MDA-MB-468 细胞中凋亡细胞比例更高, 而且 MDA-MB-468 中凋亡前体蛋白 Bax 和 Bid 表达量更高。<sup>[4]</sup>

### (二) 动物实验(体内研究)

体内实验中, 给 MCF7、BT-474、HCC1954 和 KPL4 移植瘤小鼠分别腹腔注射 Ispinesib (SCID, 8 mg/kg; nude, 10 mg/kg), Ispinesib 在所有小鼠中均表现出抗肿瘤活性, 造成肿瘤衰退。<sup>[4]</sup>

## 参考文献

- [1] Lad L, et al. Mechanism of Inhibition of Human KSP by Ispinesib. *Biochemistry*, 47(11): 3576-3585 (2008).
- [2] Davis DA, et al. Increased therapeutic potential of an experimental anti-mitotic inhibitor SB715992 by genistein in PC-3 human prostate cancer cell line. *BMC Cancer*, 6: 22 (2006).
- [3] Purcell JW, et al. Ispinesib (SB-715992) a kinesin spindle protein (KSP) inhibitor has single agent activity and enhances the efficacy of standard-of-care therapies in pre-clinical models of breast cancer. 69(2 Suppl) (2009).
- [4] Purcell JW, et al. Activity of the Kinesin Spindle Protein Inhibitor Ispinesib (SB-715992) in Models of Breast Cancer. *Clin Cancer Res*, 16(2): 566-576 (2010).