

## BIIB021

Cat. No. CEI-0987

Lot. No. (See product label)

### はじめに

**説明** BIIB021は、口投与可能な合成小分子Hsp90阻害剤です。Hsp90のATP結合ポケットに結合し ( $K_i = 1.7 \pm 0.4 \text{ nM}$ )、MCF-7細胞においてEC50が $38 \pm 10 \text{ nM}$ でHER-2の分解を誘導します。Hsp90αおよびHsp70の熱ショックタンパク質の発現を阻加させますが、非クライアントタンパク質であるホスファチジルイノシトール3キナーゼp85サブユニットの発現には影響を与えません。BIIB021は、N87、MCF-7、BT474腫瘍細胞の阻値をそれぞれIC50値0.06、0.31、0.14  $\mu\text{M}$ で阻害します。N87胃、BT474乳房、CWR22前立腺、U87神膠芽腫、SKOV3卵、Panc-1膵臓腫瘍の異種移植モデルにおいて、顕著な抗腫瘍活性を示します。

**別名** EL52, HSP86, HSP89A, HSP90A, HSP90N, HSPC1, HSPCA, HSPCAL1, HSPCAL4, HSPN, Hsp89, LAP2

### 製品情報

**外形** オフホワイトまたは薄茶色の粉

**CAS登録番号** 848695-25-0

**分子式** C14H15ClN6O

**分子量** 318.8 Da

**純度** >99%

**標的** HSP90

**IC50値** N87、MCF-7、およびBT474腫瘍細胞: IC50 0.06、0.31、および0.14  $\mu\text{M}$ 、それぞれ

**溶解度** DMSOにおいて65 mg/mlで可溶; エタノールにおいて3 mg/mlで加温すると可溶; 水には非常に難溶; 普通の水における最大溶解度は約50-100  $\mu\text{M}$ と推定される。

### 保管・発送情報

**安定性** -20°C以下で保管してください。固体の形態は、指示通りに保管した場合、受領日から少なくとも12ヶ月間安定しています。水溶液は1日以上保管しないでください。