

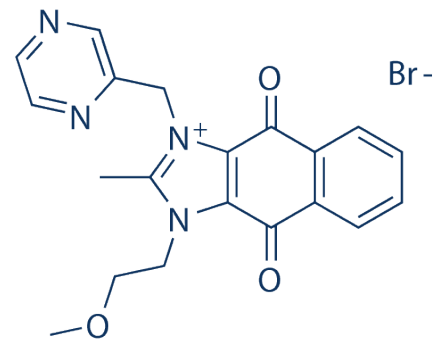
YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0128-10mM	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0128-5mg	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin 抑制剂)	5mg
SC0128-25mg	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	1-(2-methoxyethyl)-2-methyl-3-(pyrazin-2-ylmethyl)benzo [f]benzimidazol-3-ium-4,9-dione;bromide
简称	YM155
别名	Sepantronium Bromide, YM 155, YM-155, YM155 cpd
中文名	N/A
化学式	C ₂₀ H ₁₉ BrN ₄ O ₃
分子量	443.29
CAS号	781661-94-7
纯度	98.4%
溶剂/溶解度	Water 89mg/ml; DMSO 55mg/ml; Ethanol 6mg/ml
溶液配制	5mg加入1.13ml DMSO, 或者每4.43mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0128-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	YM155(Sepantronium Bromide)是一种有效的survivin抑制药, 通过抑制Survivin启动子活性而发挥作用, 在HeLa-SURP-luc和CHO-SV40-luc细胞中IC50为0.54nM; 对SV40启动子活性抑制作用不显著, 能够轻微抑制Survivin与XIAP相互作用。Phase 2。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	Survivin	—	—	—	—
IC50	0.54nM	—	—	—	—
体外研究	YM155 30μM时对SV40作用效果也不大。在p53缺陷的PC-3和PPC-1人类HRPC细胞中, 通过抑制survivin基因启动子的转录, YM155显著抑制内源性survivin的表达。相反, YM155 100nM时对c-IAP2、XIAP、Bcl-2、Bcl-xL、Bad、α-actin及β-tubulin的蛋白表达仍没抑制效果。YM155作用于人类癌细胞系包括PC-3和PPC-1, 使细胞发生凋亡, 伴随着caspase-3活性上升。YM155有效抑制人类癌细胞系(突变p53或短小p53) 包括PC-3、PPC-1、DU145、TSU-Pr1、22Rv1、SK-MEL-5及A375, IC50值为2.3到11nM。另外, YM155增强NSCLC细胞对γ-射线的敏感性。YM155和γ-射线联用, 增强凋亡细胞数和caspase-3活性。YM155推迟修复放射诱导核DNA断裂的双链。				
体内研究	YM155按3和10mg/kg皮下注射前列腺移植瘤, 结果显示YM155完全抑制PC-3的肿瘤生长, 但是重量没有降低, 血细胞数也没有下降。药物动力学分析显示YM155作用于肿瘤组织效果很明显。而且, YM155按5mg/kg作用于PC-3常位移植瘤时肿瘤抑制率达80%。YM155和γ-射线联用作用于携带H460或Calu6移植瘤的裸鼠, 显示出强抗癌活性。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	使用 Pyrobest 聚合酶和引物 5'-GCGCGCTCGAGTCTAGACATGCGGATATATTC-3' 和 5'-GCGCGAAGCTTTGGCGGTTAATGCGCGC-3', 从人类基因组DNA中分离2767个碱基对序列的人类 survivin基因启动子。在pGL3-Basic质粒的XhoI/HindIII切除位点, 内切酶XhoI/HindIII切除产生的PCR片段。产生的质粒称为pSUR-luc。通过DNA测序仪在所有增强序列处测定DNA序列。通过荧光酶素实验, 使

	用短暂转染的HeLa-S3细胞，测定pSUR-luc的活力。使用的pGL3质粒含有SV40启动子和增强子序列。pSUR-luc和pSV2bsr质粒通过Lipofectamin2000稳定转染到HeLa细胞中。加入10µg/ml灭瘟素，根据适当的荧光酶素信号和基因稳定性，筛选HeLa-SURP-luc单一群落。pGL3和pSV2bsr质粒稳定转染到CHO细胞中。加入10µg/ml灭瘟素，根据适当的荧光酶素信号和基因稳定性，筛选CHO-SV40-luc单一群落。从HeLa-SURP-luc和CHO-SV40-luc群落中获得细胞用于化学筛选。细胞按每孔 5×10^3 接种在96孔板上，加入YM155(溶于DMSO中)。24小时后测定荧光酶素活性。通过回归分析计算IC50值。
--	--

细胞实验	
细胞系	PC-3、PPC-1、DU145、TSU-Pr1、22Rv1、SK-MEL-5和A375细胞
浓度	1µM左右
处理时间	48小时
方法	PC-3、PPC-1、DU145、TSU-Pr1、22Rv1、SK-MEL-5及A375细胞系按5到 40×10^3 密度接种在96孔板上。YM155溶解在DMSO中，持续处理细胞48小时。通过sulforhodamine B试剂测定细胞数。

动物实验	
动物模型	皮下注射PC-3移植瘤的雄性裸鼠(BALB/c nu/nu)
配制	溶于盐溶液，再用盐溶液稀释。
剂量	5mg/kg
给药方式	皮下注射，每周持续处理3天，处理3周。

参考文献：

1. Nakahara T, et al. Cancer Res. 2007; 67(17):8014-8021.
2. Iwasa T, et al. Clin Cancer Res. 2008; 14(20):6496-6504.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0128-10mM	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin抑制剂)	10mM × 0.2ml
SC0128-5mg	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin抑制剂)	5mg
SC0128-25mg	YM155 (Sepantronium Bromide) (Survivin抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件：

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

注意事项：

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.08.16