

## BIIB021

Cat. No. CEI-0987

Lot. No. (See product label)

### Einleitung

#### Beschreibung

BIIB021 ist ein oral verfügbares, synthetisches kleines Molekül, das als Hsp90-Inhibitor wirkt. Es bindet an die ATP-Bindungstasche von Hsp90 ( $K_i = 1,7 \pm 0,4$  nM) und induziert den Abbau von HER-2 mit einem  $EC_{50}$  von  $38 \pm 10$  nM in MCF-7-Zellen. Es erhöht die Expression der Hitzeschockproteine Hsp90 $\alpha$  und Hsp70, hat jedoch keinen Einfluss auf die Expression des Nicht-Client-Proteins Phosphatidylinositol-3-Kinase p85-Untereinheit. BIIB021 hemmt die Proliferation von N87-, MCF-7- und BT474-Tumorzellen mit  $IC_{50}$ -Werten von 0,06, 0,31 und 0,14  $\mu$ M. Es zeigt signifikante antitumorale Aktivität in N87-Magen-, BT474-Brust-, CWR22-Prostata-, U87-Glioblastom-, SKOV3-Eierstock- und Panc-1-Pankreas-Tumor-Xenograft-Modellen.

#### Synonyme

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

### Produktinformation

#### Aussehen

Off-White oder hellbraunes Pulver

#### CAS-Nummer

848695-25-0

#### Molekülformel

C<sub>14</sub>H<sub>15</sub>CIN<sub>6</sub>O

#### Molekulargewicht

318.8 Da

#### Reinheit

>99%

#### Ziele

HSP90

#### IC<sub>50</sub>-Wert

N87, MCF-7 und BT474 Tumorzellen:  $IC_{50}$  0,06, 0,31 und 0,14  $\mu$ M, jeweils

#### Löslichkeit

Löslich in DMSO bei 65 mg/ml; löslich in Ethanol bei 3 mg/ml bei Erwärmung; sehr schlecht löslich in Wasser; die maximale Löslichkeit in reinem Wasser wird auf etwa 50-100  $\mu$ M geschätzt.

### Lager- und Versandinformation

#### Stabilität

Lagern Sie bei oder unter -20 °C. Die feste Form ist mindestens 12 Monate ab dem Empfangsdatum stabil, wenn sie wie angegeben gelagert wird. Lagern Sie wässrige Lösungen nicht länger als einen Tag.