

SM-164 (XIAP 抑制剂)

产品介绍

SM-164 是细胞渗透性 Smac 类似物, 与含有 BIR2 和 BIR3 结构域的 XIAP 蛋白结合, IC50 值为 1.39 nM, 它用作 XIAP 的强效拮抗剂。

化学信息

1) 分子量: 1121.42

2) 分子式: C₆₂H₈₄N₁₄O₆

3) CAS No.: 957135-43-2

4) Smiles:

```
[H][C@]12CC[C@H](N1C(=O)[C@H](CCCC2)NC(=O)[C@H](C)NC)C(=O)N[C@H](c1cn(CCCCc2ccc(CCCcn3cc(nn3)[C@@H](NC(=O)[C@@H]3CC[C@]4([H])CCCC[C@H](NC(=O)[C@H](C)NC)C(=O)N34)c3ccccc3)cc2)nn1)c1cccc1
```

5) 密度: 1.33 g/cm³ (Predicted)

生物活性

产品描述	SM-164 binds to XIAP protein containing both the BIR2 and BIR3 domains (IC50: 1.39 nM). It acts as an extremely potent antagonist of XIAP.
靶点活性	CIAP1:0.31 nM (Ki), CIAP2:1.1 nM (Ki)
体外活性	SM-164 与 XIAP 结合, 其效能分别比其单价同类物以及天然 Smac AVPI 肽高出 300 倍与 7000 倍。通过基于荧光极化的测定法确定了 SM-164 对 XIAP、cIAP-1 和 cIAP-2 蛋白的结合亲和力。SM-164 能够与 XIAP 中的两个 BIR 结构域同时作用, 并以超高效的拮抗剂在无细胞和细胞水平的实验中展现对 XIAP 的抑制作用。SM-164 针对细胞性 XIAP, 并能在低至 1 nM 的浓度下显著诱导白血病细胞的凋亡, 而在高达 10,000 nM 的浓度下对正常人初代细胞的毒性微乎其微。SM-164 对包含 BIR2 和 BIR3 两个结构域的 XIAP 蛋白的 Ki 值为 0.56 nM, 对含有 BIR2 和 BIR3 的 cIAP-1 蛋白的 Ki 值为 0.31 nM。SM-164 对含有 BIR3 的 cIAP-2 蛋白的 Ki 值为 1.1 nM。
体内活性	SM-164 在抑制肿瘤生长方面表现出高效性, 能够实现 MDA-MB-231 异种移植模型的肿瘤退化。SM-164 (1 mg/kg) 的治疗在疗程期间完全抑制了肿瘤生长。SM-164 (5 mg/kg) 的治疗使得治疗开始时 (第 25 天) 肿瘤体积 147±54 mm ³ 减少到治疗结束时 (第 36 天) 的 54±32 mm ³ , 下降了 65%。SM-164 的抗肿瘤活性强烈而持久, 并非短暂。治疗结束时, SM-164 (5 mg/kg) 的效果在统计学上显著优于 Taxotere (P<0.01), 或当对照组肿瘤大小达到 750 mm ³ 时 (P<0.02)。

储存&溶解度

存储: 粉末: -20°C 保存 3 年

溶液: -80°C 保存 1 年

冰袋运输

溶解度信息: DMSO: 5.2 mg/mL (4.64 mM), 建议使用超声波。

(<1mg/ml 是指产品微溶或不溶)

DMSO

	1mg	5mg	10mg
1 mM	0.8917 mL	4.4586 mL	8.9173 mL
5 mM	0.1783 mL	0.8917 mL	1.7835 mL
10 mM	0.0892 mL	0.4459 mL	0.8917 mL
50 mM	0.0178 mL	0.0892 mL	0.1783 mL

请根据产品在水中的溶解度选择合适的溶剂来制备储备溶液不同的溶剂。

请尽快使用。

本产品仅用于生命科学研究，不得用于医学诊断及其他用途！