

**酮康唑 ; Ketoconazole**

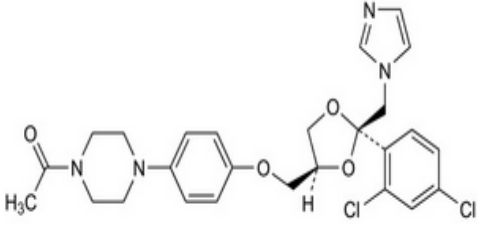
产品编号 : MB1132

质量标准 : >99%,BR

包装规格 : 5 G ; 25G ;

产品形式 : 粉末

**基本信息**

分子式	C <sub>26</sub> H <sub>28</sub> Cl <sub>2</sub> N <sub>4</sub> O <sub>4</sub>	结构式	
分子量	531.44		
CAS No.	65277-42-1		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	溶于二氯甲烷、甲醇 乙醇 7mg/mL 加热 DMSO 5 mg/mL 加热  部分溶于乙醇(96%)  几乎不溶于水		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介 :** 是咪唑类抗真菌剂, 是经典的 CYP3A4 抑制剂, 也是 CYP24A1 的抑制剂。

**物理性状及指标 :**

外观.....白色或者类白色粉末。

熔点.....148°C ~ 152°C

溶解性.....溶于二氯甲烷、甲醇 ; 乙醇 7mg/mL 加热 ; DMSO 5 mg/mL 加热 ; 部分溶于乙醇 (96%) ; 几乎不溶于水

旋光度.....-0.10° ~ +0.10°

干燥失重.....≤0.5%

含量.....99.0% ~ 101.0%

重金属.....≤20ppm

细胞培养测试.....Pass

**生物活性 :** Ketoconazole 与[3H]Dexamethasone 竞争性地结合到成纤维细胞糖皮质激素受体, IC<sub>50</sub> 为 0.3 mM。Ketoconazole 作用于 HT29-S-B6 结肠癌细胞, 降低细胞增殖, [3H]胸苷渗透, IC<sub>50</sub> 为 2.5 mM, 这种作用具有剂量依赖性。Ketoconazole 作用于 Evsa-T 细胞系和 MDA-MB-231 细胞系, 抑制[3H]胸苷渗透, IC<sub>50</sub> 分别为 2 μM 和 13 μM。Ketoconazole 作用于 HT29-S-B6 细胞, 在 24 小时内, 诱导 S 期细胞数减少 (从 17%降低至 3%), 这种作用具有剂量依赖性, G<sub>0</sub>-G<sub>1</sub> 期细胞百分数则相应增加 (从 64% 增加至 80%)。Ketoconazole 对几种 Malassezia 菌种很敏感, 最小抑制浓度 (MICs) 为 0.03 μg/m。

**用途及描述 :** 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。酮康唑为化学合成吡咯类(azoles)抗真菌药, 具广谱抗真菌作用, 对念珠菌、着色真菌、球孢子菌、隐球菌、组织胞浆菌、皮炎芽生菌、孢子丝菌等均具抗菌活性。对毛发癣菌亦具抗菌作用。作用机制为药物直接损伤真菌的细胞膜, 使其通透性发生改变, 细胞内重要物质摄取受影响或漏失而使真菌死亡。酮康唑在低浓度时为抑菌作

用，高浓度时具杀菌作用。有抑制真菌作用，高浓度时也可具杀菌作用。本品可抑制麦角甾醇或其他甾醇类的生物合成，损伤真菌细胞膜和改变其通透性，以致重要的细胞内物质外漏；本品也可抑制真菌的甘油三酯和磷脂的生物合成，抑制氧化酶和过氧化酶的活性，引起细胞内过氧化氢积聚导致细胞亚微结构的变性和细胞坏死。对白色念珠菌则可抑制其自芽胞转变为具侵袭性的菌丝形式的过程。

#### 使用方法推荐:

#### 储液配置：

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8817 mL	9.4086 mL	18.8172 mL
5 mM	0.3763 mL	1.8817 mL	3.7634 mL
10 mM	0.1882 mL	0.9409 mL	1.8817 mL
50 mM	-	-	-

**动物体内实验配置方法：**从左到右依次将纯溶剂加入产品，现配现用：30% Propylene glycol, 5% Tween 80, 65% D5W，溶解度 30 mg/mL。

#### 【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

#### 部分客户使用美仑产品发表文献举例

- Spheroid culture of primary hepatocytes with short fibers as a predictable in vitro model for drug screening.
- Micropatterned coculture of hepatocytes on electrospun fibers as a potential in vitro model for predictive drug metabolism.
- Hepatocyte spheroid culture on fibrous scaffolds with grafted functional ligands as an in vitro model for predicting drug metabolism and hepatotoxicity.