

伏立诺他 ; Vorinostat ; SAHA ; MK0683

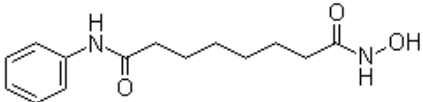
产品编号 : MB1265

质量标准 : >99%,可用于细胞培养

包装规格 : 100MG;1G;5G

产品形式 : 白色至浅橙色结晶或结晶性粉末

基本信息

分子式	C14H20N2O3	结构式	
分子量	264.32		
CAS No.	149647-78-9		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 52 mg/mL (196.74 mM) Ethanol : 3 mg/mL (11.35 mM) DMF (~20 mg/ml) Water : Insoluble		
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。		

物理性状及指标 :

外观 :白色至浅橙色结晶或结晶性粉末

熔点 :158.0-162.0°C

溶解性 :溶于乙醇(3 mg/ml), DMSO (52 mg/ml), DMF (~20 mg/ml), 几乎不溶于水

 密度 :~1.2 g/cm³ (预测)

干燥失重 :≤1.0%

含量 :99.0%~101.0%

IC50 :HDAC (组蛋白去乙酰化酶) 8: IC50 >1 nM (人); HDAC7: IC50 >1 nM (人);

.....HDAC4: IC50 >1 nM (人); HDAC5: IC50 >1 nM (人); MCF7: IC50 = 0.13 µg/ml (人)

生物活性

产品描述	Vorinostat (suberoylanilide hydroxamic acid, SAHA)是一种 HDAC 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 为~10 nM。
特性	Vorinostat 是广谱 HDAC 活性抑制剂, 抑制 I 和 II 类酶。
靶点	HDAC (Cell-free assay) ~10 nM
体外研究	Vorinostat 是小分子量 (<300) 线性酰胺, 抑制 HDAC 活性, 包括乙酰化组蛋白和非组蛋白的积累, 抑制培养细胞的增殖, 且抑制肿瘤生长。Vorinostat 通过结合到酶的活性位点而抑制 HDAC 活性。Vorinostat 抑制多种转化细胞增殖 (包括 淋巴瘤, 多发性骨髓瘤, 白血病, 和非小细胞肺癌), 与对照组相比抑制生长达 50% 时的浓度为 0.5 到 10µM。Vorinostat 作用于淋巴瘤和白血病细胞, 包括 Burkitt, B-细胞急性淋巴细胞白血病 (B-ALL), MCL, DLBCL, ATL 和 T-细胞, 不同程度抑制细胞增殖。除了抑制转化细胞增殖, Vorinostat 也抑制正常细胞增殖, 通过比较 Vorinostat 作用于—组细胞系—正常人非纤维细胞(WI-38)和 SV40 巨大 T 抗原转化

<p>WI-38(VA-13 细胞)而得到证明。Vorinostat 抑制两种类型细胞增殖,这种作用存在剂量依赖性。但发现 Vorinostat 对转化细胞具有选择毒性,包括使肿瘤细胞死亡,而对正常细胞只起抑制作用,不会使其死亡。Genistein 和 Vorinostat 联用效果比 5-aza 和 Vorinostat 联用作用于诱导细胞死亡有效很多。Genistein 和 Vorinostat 联用作用于 ARCaP-E 使增殖降低 80%,作用于 ARCaP-M 细胞,增殖降低 60%以上。Genistein 和 Vorinostat 联用抑制细胞增殖具有协同效应。作用于 ARCaP-E 细胞(820 个基因 诱导和 1046 个基因抑制) ARCaP-M 细胞, Vorinostat 比 Genistein 影响更多基因。Vorinostat 作用于肿瘤细胞表面,提高 Fas 蛋白水平,这种作用存在剂量依赖性,且按 0.75 μM 剂量处理,提高达到一个稳定水平。Vorinostat 抑制肿瘤细胞生长,包括 NB4, H460 和 HCT-116, IC50 分别为 0.7μM, 3.4μM 和 1.2 μM。</p>
--

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。伏立诺他是一组蛋白脱乙酰酶 (HDAC) 抑制剂。体外研究表明,本品在纳摩尔浓度 (IC50 < 86nM) 抑制 HDAC1, HDAC2 和 HDAC3 以及 HDAC6 酶活性。在某些癌细胞内,过量的 HDAC 酶抑制可控制正常细胞活性的基因激活。伏立诺他降低 HDAC 活性有助于减缓或终止癌细胞生长的基因激活。伏立诺他抗癌作用的确切机制尚未完全阐明。

储液配置

体 积 \ 浓 度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.7836 mL	18.9179 mL	37.8358 mL
5 mM	0.7567 mL	3.7836 mL	7.5672 mL
10 mM	0.3784 mL	1.8918 mL	3.7836 mL
50 mM	0.0757 mL	0.3784 mL	0.7567 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>组蛋白去乙酰化酶活性测定: 为了进行 HDAC 实验 24 × 104 dpm 乙醇溶液(1 mCi/ml)中提供的 sup>3H-醋酸钠盐标记的组蛋白 H4 等份样, 加到每个试管中, 试管中含悬浮在 25 μL 实验 buffer(100 mM Tris-HCl pH 8, 2mM EDTA)中的 200 μg 全部 HeLa 细胞裂解液进行免疫沉淀获得的 HDAC。加入不同浓度 Vorinostat, 在 30$^{\circ}\text{C}$ 下温育 90 分钟。加入 20 μL 终止缓冲液(0.5 N HCl, 0.08 M AcOH)终止反应。加入 0.8 mL TBME 提取释放放入氚醋酸盐。在 8,000 × g 转速下离心 5 分钟, 600 μL 有机相(上相) 转移到包含 3 mL 闪烁液的闪烁瓶中。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: NB4, NCI-H460 和 HCT-116 肿瘤细胞系 Concentrations: 0 μM - 0.1 μM Incubation Time: 48 小时 Method: NB4, NCI-H460 和 HCT-116 肿瘤细胞系生长在 200 μL 96 孔板中, 约 10%汇合, 生长 24 小时后, 覆盖孔中。使用多种浓度 Vorinostat 或溶剂处理肿瘤细胞 24 小时。处理后, 冲洗实验板, 移除 Vorinostat, 温育 48 小时。使用 sulphorodamine B 实验测定 Vorinostat 处理后存活细胞的分。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 CT26 细胞的 Fasgld BALB/cByJ 小鼠 Formulation: Dissolved in DMSO Dosages: 25 mg/kg Administration: 静脉注射</p>

【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。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。