

**Everolimus ; RAD001 ; 依维莫司**

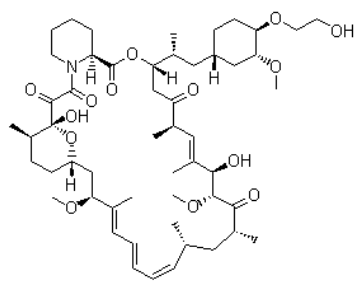
产品编号 : MB1449

质量标准 : >95%,mTOR 抑制剂,BR

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : 灰白色至淡黄色粉末

**基本信息**

分子式	C53H83NO14	结构式	
分子量	958.22		
CAS No.	159351-69-6		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 100 mg/mL (104.36 mM) Water Insoluble Ethanol : 7 mg/mL (7.3 mM)		
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:** 依维莫司 Everolimus 是一种高特异性的靶向试剂, 使离体的 FKBP-12, 或 FKBP-12 复合体结合到 mTOR, IC50 为 5 到 6 nM。

**别名:** 依维莫司;RAD001; SDZ-RAD; Certican; Zortress; Afinitor;RAD 001;40-O-(2-Hydroxyethyl)rapamycin; 42-O-(2-Hydroxy)ethyl Rapamycin

**物理性状及指标 :**

外观 : .....灰白色至淡黄色粉末

熔点 : .....110-115 °C

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (104.36 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 7 mg/mL (7.3 mM)

密度 : .....1.18 g/cm<sup>3</sup> (预测)

IC50 : .....在 VEGF 诱导 HUVEC50 增生中抗血管生成的效果 : IC50 = 0.12 nM;

.....MTOR: IC50 = 0.63 nM;在 bFGF 诱导的 HUVEC50 增生中对血管的影响 IC50 = 0.8 nM

**储存条件:** -20°C , 避光防潮密闭干燥

**生物活性**

<b>产品描述</b>	Everolimus (RAD001)是一种 mTOR 抑制剂, 作用于 FKBP12, 在无细胞试验中 IC50 为 1.6-2.4 nM。
<b>靶点</b>	mTOR (FKBP12) (Cell-free assay) 1.6 nM-2.4 nM
<b>体外研究</b>	体外, 与 Rapamycin 相比, Everolimus 具有抑制免疫活性。Everolimus 与固定化的 FK 506 竞争性结合到生物素化的 FKBP12 上, IC50 为 1.6 nM-2.4 nM,且作用于 BALB/c 和 CBA 小鼠脾脏细胞, 抑制双向 MLR, IC50 为 0.12 nM-1.8 nM。Everolimus 作用于 VEGF 诱导的 HUVEC 增殖和 bFGF 诱导的 HUVEC 增殖, 具有抗血管生成/血管效果, IC50 分别为 0.12 nM 和 0.8 nM。最新研究显示 Everolimus 抑制 BT474 细胞系和原发性乳腺癌细胞的全部细胞和干细胞, 作用于

	原发性乳腺癌的全部细胞时 IC50 为 156 nM ,作用于 BT474 细胞的全部细胞时 ,IC50 为 71 nM。此外, Everolimus 和 Trastuzumab 联用 显著促进对肿瘤干细胞生长的抑制作用 抑制率提高 50% 以上。
<b>体内研究</b>	Everolimus (0.1 到 10 mg/kg)抑制 B16/BL6 黑色素瘤的原代生长和淋巴结转移, 伴随着全部血管数降低, 这种作用存在剂量依赖性。Everolimus 作用于携带 BT474 干细胞移植瘤动物模型, 与对照组相比 ( 体积为 698 mm3 ), 显著降低平均肿瘤尺寸(590.6 mm3)。而且,与 Everolimus 单独处理相比, Everolimus 和 Trastuzumab 联用显著降低移植瘤尺寸 (410.8 mm3)。

**美仑相关产品推荐**

MB21165	依维莫司-d4
---------	---------

**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。依维莫司 Everolimus 是一种高特异性的靶向试剂, 使离体的 FKBP-12, 或 FKBP-12 复合体结合到 mTOR, 可以用于相关领域的科学研究。

**储液配置**

体 积 \ 浓 度	质 量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.0436 mL	5.2180 mL	10.4360 mL
5 mM		0.2087 mL	1.0436 mL	2.0872 mL
10 mM		0.1044 mL	0.5218 mL	1.0436 mL
50 mM		0.0209 mL	0.1044 mL	0.2087 mL

**经典实验操作 ( 仅供参考 )**

<b>激酶实验</b>	FKBP12 结合试验及混合淋巴细胞反应 ( MLR ) : FKBP12 结合实验 : 通过 ELISA-型竞争性检测法直接测量与 FK 506 结合蛋白(FKBP12)的结合情况。每组实验中的 FK 506 作为标准与 FK 506 相比, 抑制活性表示为相对 IC50 值。(rIC50 = IC50 Everolimus /IC50 FK 506)。混合淋巴细胞反应 (MLR): 在双向 MLR 中, 使用 BALB/c 和 CBA 小鼠脾细胞, 测量 RAP 及其衍生物的抑制免疫反应活性。每组实验中 RAP 作为标准, 与 RAP 相比, 抑制活性表示为相对 IC50 值(rIC50 = IC50 Everolimus /IC50 RAP)。
<b>细胞实验</b>	Cell lines: BT474 细胞系和原发性乳腺癌细胞 Concentrations: 0.001 μM 到 10 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 通过 MTT 实验比较 Everolimus 或 Trastuzumab 作用于全部乳腺癌细胞和乳腺 CSCs 的效果。BT474 细胞系和原发性乳腺癌细胞的全部细胞和干细胞分别接种在含不同浓度药物的 96 孔板中, 每种浓度重复放置 5 个孔, 然后细胞在 37oC 下温育 24 小时。Everolimus 浓度为 1 nM, 10 nM, 100 nM, 1 μM 和 10 μM, Trastuzumab 浓度为 0.5 μg/mL, 1 μg/mL, 10 μg/mL, 50 μg/mL和 100 μg/mL。通过 MTT 实验, 使用 10 μg/mL Trastuzumab 和浓度不断增高的 Everolimus (1 nM, 10 nM, 100 nM 和 1 μM), 测定 Everolimus 和 Trastuzumab 联用, 在体外作用于乳腺 CSCs 生长的效果。药物处理 24 小时后, 每孔加入溶于 PBS 的 20 μL 5 mg/mL MTT, 然后细胞在 37oC 下在含 5 % CO2 及饱和湿度环境下温育 4 小时。随后除去上清液, 每孔加入 150 μL DMSO, 细胞涡旋 10 分钟。使用 ELISA 读数器测定每孔的吸光值 ( OD 值 )。每组实验重复进行三次, 绘制剂量反应曲线。使用用于 Windows 的概率统计软件包 SPSS17.0 软件计

	算 IC50 值。
<b>动物实验</b>	Animal Models: 在左乳房垫下方注射培养的 BT474 干细胞的 BALB/ C 裸鼠 Formulation: 溶于盐水中 Dosages: $\leq 2$ mg/kg Administration: 口服处理

**【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。