

## DBeQ

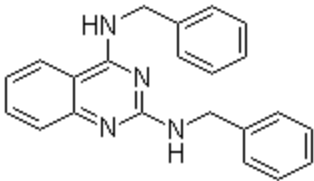
产品编号：MB3668

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;25MG;100MG

产品形式：粉状

### 基本信息

分子式	C22H20N4	结 构 式	
分子量	340.42		
CAS No.	177355-84-9		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 68 mg/mL (199.75 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 5 mg/mL (14.68 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：**DBeQ 是一种有效的，选择性的，ATP 竞争性的 p97 抑制剂，对 p97(wt) 和 p97(C522A) 的 IC<sub>50</sub> 值分别为 1.5 μM 和 1.6 μM，同时可抑制 Vps4，IC<sub>50</sub> 值为 11.5 μM。

**别名：**JRF 12, N2,N4-dibenzylquinazoline-2,4-diamine

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 68 mg/mL (199.75 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 5 mg/mL (14.68 mM)

含量：.....>98%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	DBeQ 是选择性的，有效的，可逆的，ATP 竞争性的 p97 抑制剂，IC <sub>50</sub> 为 1.5 μM。
<b>靶点</b>	p97
<b>IC<sub>50</sub></b>	1.5 μM
<b>体外研究</b>	DBeQ 作用于 HeLa 细胞 抑制 UbG76V-GFP, ODD-Luc 和 Luc-ODC 降解, IC <sub>50</sub> 分别为 2.6 μM, 56 μM 和 45 μM。DBeQ 作用于 N-ethylmaleimide-敏感因子 (NSF) 和 26S 蛋白酶，效果至少低 50 倍。DBeQ 与 ATP 竞争性抑制 P97, K <sub>i</sub> 为 3.2 μM，说明 DBeQ 结合到 D2 域的活性位点。DBeQ (10 μM) 作用于 HEK293 细胞，有效抑制 TCRα-GFP 降解。DBeQ 作用于 HEK293 细胞，3 小时内诱导 CHOP，但不增加 p21 水平，这种作用存在浓度依赖性。DBeQ (15 μM) 作用于 HeLa 细胞，诱导 LC3-II 在在细胞核及浓缩膜和胞质级组中大量积累。DBeQ 作用于 HeLa 细胞，通过抑制 LC3-II 自噬降解，而不是诱导自噬，而发挥作用。DBeQ (10 μM) 作用于 HeLa 细胞，快速促进 caspases-3 和-7 激活。比激活外在 caspase-8 通路，DBeQ 更有效激活内在 caspase-9 凋亡途径，而 STS 激活两种途径程度相似。DBeQ 作用于 多发性骨髓瘤细胞 (RPMI8226) 比作用于正常人胚肺成纤维细胞 (MRC5) 效果强 5 倍，HeLa 细胞和 Hek293

	细胞具有中等的敏感性。在 ERAD 和自噬途径内, DBeQ 干扰底物降解。DBeQ (12 $\mu$ M) 作用于 HeLa 细胞中。抑制细胞中和, 这种作用存在剂量依赖性。DBeQ(10 $\mu$ M)完全抑制病毒和抗体的降解, 但不抑制 IgG Fc 的降解。DBeQ 作用于 U20S 细胞, 降低基本的和营养刺激的 MTOR 靶点磷酸化, 与 Rapamycin 效果类似。
特征	DBeQ 快速有效地诱导 caspase 激活和细胞死亡。

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB3807	NMS-873
MB3831	MNS (3,4-Methylenedioxy- $\beta$ -nitrostyrene, MDBN)

**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。DBeQ 是一种有效的 ATPase p97 特异性抑制剂, 是泛素融合降解(UFD)通路的重要组成部分。DBeQ 抑制泛素化蛋白降解、内质网相关降解途径和自噬体成熟。该化合物还能有效抑制细胞增殖, 诱导 caspase 3/7 活性和凋亡。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.9375 mL	14.6877 mL	29.3755 mL
5 mM		0.5875 mL	2.9375 mL	5.8751 mL
10 mM		0.2938 mL	1.4688 mL	2.9375 mL
50 mM		0.0588 mL	0.2938 mL	0.5875 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验:</b>	<p><b>手动 ATP 酶实验:</b>                      实验 Buffer [20 <math>\mu</math>L 2.5<math>\times</math>浓度, 1<math>\times</math>= 50 mM Tris (pH 7.4), 20 mM MgCl<sub>2</sub>, 1 mM EDTA, 和 0.5 mM tris(2-carboxyethyl)phosphine (TCEP)] 加到 96 孔板中。纯化的 p97(25 <math>\mu</math>L 50 <math>\mu</math>M) 975 <math>\mu</math>L 1<math>\times</math> 实验 Buffer 中稀释, 然后每孔中加入 10 <math>\mu</math>L。每孔加入 DBeQ (10 <math>\mu</math>L) 或 5% DMSO (10 <math>\mu</math>L), 实验板在室温下温育 10 分钟。按如下进行 ATP 酶实验: 每孔加入 10 <math>\mu</math>L 500 <math>\mu</math>M ATP (pH 7.5), 在室温下温育 60 分钟, 然后加入 50 <math>\mu</math>L Kinase Glo Plus 试剂, 随后在室温下黑暗环境中温育 10 分钟。使用 Analyst AD 读取发光值。在一个浓度范围(0, 0.048, 0.24, 1.2, 6, 和 30 <math>\mu</math>M)按一式三份测定 DBeQ。</p>
<b>细胞实验:</b>	<p><b>Cell lines:</b> MRC-5, Hek293, HeLa 和 RPMI8226 细胞  <b>Concentrations:</b> 33 <math>\mu</math>M  <b>Incubation Time:</b> 48 小时  <b>Method:</b> 细胞按每孔 5,000 个接种于 384 孔白色固体板中。使用荧光素酶 siRNA 或 p97siRNA (10 nM) 进行细胞转染 48 小时, 或在指定时间使用 DBeQ 处理。每孔加入 Caspase-3/7 Glo, caspase-6 Glo, caspase-8 Glo, 或 caspase-9, 按 500rpm 震荡混合 1 分钟。在室温下温育 1 小时后, 测定发光信号。使用 CellTiter-Glo 试剂测定细胞存活力。为了测定细胞活力的 IC<sub>50</sub>, 使用七种浓度的 MG132 或 DBeQ (开始于 <math>\mu</math>M 的三倍连续稀释液) 处理细胞 48 小时。拟合发光信号归一化 DMSO 处理细胞的百分比, 计算 IC<sub>50</sub> 值。</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。