

Romidepsin (FK228, Depsipeptide) ; 罗米地辛

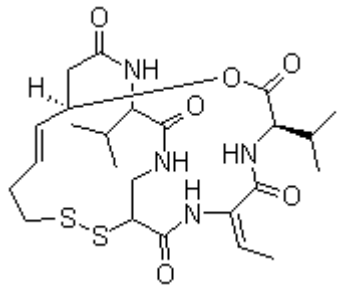
产品编号 : MB3722

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 1MG;5MG;10MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₃₆ N ₄ O ₆ S ₂	结 构 式	
分子量	540.7		
CAS No.	128517-07-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 10 mg/mL (18.49 mM) Water Insoluble Ethanol 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。		

简介 : 罗米地辛 Romidepsin 是一种有效的 HDAC1 和 HDAC2 抑制剂, IC₅₀ 值分别为 36 nM 和 47 nM。

别名 : Depsipeptide, FK228, FR901228, L-Valine,

Cyclo[(2Z)-2-amino-2-butenoyl-L-valyl-(3S,4E)-3-hydroxy-7-mercapto-4-heptenoyl-D-valyl-D-cysteinyl] cyclic (35)-disulfide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 10 mg/mL (18.49 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Romidepsin (FK228, Depsipeptide)是一种有效的 HDAC1 和 HDAC2 抑制剂, 无细胞试验中 IC ₅₀ 分别为 36 nM 和 47 nM。
特性	Romidepsin 对 I 型 HDAC 的抑制作用明显强于对 II 型 HDAC 的抑制。

靶点	HDAC1 (Cell-free assay)	HDAC2 (Cell-free assay)
	36 nM	47 nM
体外研究	Romidepsin 抑制 NSCLC 细胞系生长, IC50 范围从 1.3 ng/mL 到 4.9 ng/mL。Romidepsin 可以降低 Erlotinib 对 NSCLC 细胞系的 IC50 值, 增加 NSCLC 细胞系对 Erlotinib 的敏感性。Romidepsin 处理 72 小时可以抑制 6/6 人 NB 肿瘤细胞系的生长, 而 NIH3T3 细胞系并不受影响。Romidepsin 对于单拷贝或 N-myc 多拷贝的 NB 细胞系以及含有正常或突变的 p53 和含有 Alk 突变体的细胞系都有选择性的细胞毒性, 这种毒性具有剂量依赖的特性。	
体内研究	与 PBS 处理的对照组相比, 单独使用 Erlotinib 和 Romidepsin 分别可以对 NCI-H1299 细胞系的异种移植生长抑制到 72% 和 43%, 但是并不具有明显的统计学意义。只有当两种药物联用的时候才会对其生长造成明显的抑制作用, 此时生长被抑制到 28%。在免疫功能低下的小鼠中, Romidepsin 会抑制皮下 NB 异种移植的生长, 这种抑制作用具有剂量依赖的特性。此外, 在 NB 病人的肿瘤组织中 Romidepsin 会诱导某些基因的表达, 如 p21 和 p75 以及 NTRK (TrkA)	

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)

MB3740	JNJ-26481585
MB3550	LMK235
MB3741	MC1568

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。Romidepsin 是一种非常有效的 HDAC1 和 HDAC2 的天然前药抑制剂, 通过谷胱甘肽转化为活性形式。Romidepsin 杀灭过表达 Bcl-2 和 Bcl-XL 的淋巴瘤细胞系, 可用于用于治疗皮肤 t 细胞淋巴瘤(CTCL)和周围 t 细胞淋巴瘤, 以及各种其他癌症等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	1.8495 mL	9.2473 mL	18.4945 mL
5 mM	0.3699 mL	1.8495 mL	3.6989 mL
10 mM	0.1849 mL	0.9247 mL	1.8495 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	HDAC-inhibitory 活动:酶测定,10 μ L[3 h]acetyl-labeled 组蛋白(25000 cpm / 10 μ g)被添加到 90 μ L HDAC 酶分数从 293 t 细胞 overexpressing HDAC1 或 HDAC2 Romidepsin 浓度的增加,和混合是在 37 摄氏度的环境中 15 分钟。酶反应至少 1 小时是线性的。反应停止添加 10 μ L 浓盐酸。释放的[3H]乙酸用 1 mL 乙酸乙酯萃取, 0.9 mL 溶剂层加入 5ml 水计数闪烁剂 II 溶液中进行放射性测定。IC50 值由至少三条独立的剂量-反应曲线确定。
细胞实验：	<p>Cell lines: NCI-H1975, NCI-H157, NCI-2882, NCI-H460 和 HCC95 细胞系</p> <p>Concentrations: 1 ng/mL</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 使用 MTS 法分析药物敏感性。在 96 孔平板中每孔接种 2\times10³ 个细胞(包括 NCI-H1975, NCI-H157, NCI-2882, NCI-H460 和 HCC95)。24 小时后, 在存在或者缺少 1 ng/mL Romidepsin 的条件下将细胞与不同浓度 (0.01 μM - 250 μM) 的 Erlotinib 37$^{\circ}$C 孵育 72 小时。MTS 溶液加到每个孔中 37$^{\circ}$C 孵育 1 小时。利用分光光度计测量 490 nm 处的光密度值。每种药物浓度的实验都设置 8 个复孔并重复两次。基于细胞生存曲线的吸光度值计算药物的半抑制浓度 (IC50)。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 携带 NCI-H1299 细胞的 BALB/c 无胸腺裸小鼠</p> <p>Formulation: 用 PBS 配制</p> <p>Dosages: 1.2 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射</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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。