

Mocetinostat ; MGCD0103

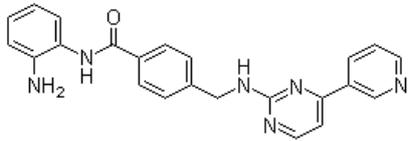
产品编号 : MB3723

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : powder

基本信息

分子式	C23H20N6O	结 构 式	
分子量	396.44		
CAS No.	726169-73-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 13 mg/mL (32.79 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 : Mocetinostat (MGCD0103)是一种有效, 可口服和同种型选择性的 HDAC (Class I/IV) 抑制剂, 抑制 HDAC1, HDAC2, HDAC3 和 HDAC11。

别名 : GCD0103;MGCD 0103;MGCD-0103;

N-(2-Aminophenyl)-4-([(4-(pyridin-3-yl)pyrimidin-2-yl]amino)methyl)benzamide

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色粉末

溶解性 :DMSO : 13 mg/mL (32.79 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	Mocetinostat (MGCD0103)是一种有效的 HDAC 抑制剂, 对 HDAC1 抑制作用最强, 无细胞试验中 IC50 为 0.15 μM, 比作用于 HDAC2, 3, 和 11 选择性高 2 到 10 倍, 对 HDAC4, 5, 6, 7, 和 8 没有抑制活性。			
靶点	HDAC1	HDAC2	HDAC11	HDAC3

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	0.15 μ M	0.29 μ M	0.59 μ M	1.66 μ M
体外研究	MGCD0103 按剂量依赖性在纳摩尔浓度或低微摩尔浓度时只能抑制 9 个人类重组 HDACs 中的一部分, 包括 HDAC1, HDAC2, HDAC3, 和 HDAC11。在体外, MGCD0103 有效抑制人类 HDAC1 和 HDAC2 酶, 但是不抑制二级 HDACs。MGCD0103 的外环氨基抑制酶时是必需的, 因为作用于 HDAC1 和 HDAC2 的 HDAC 抑制活性已被 desamino 类似物全部消除。MGCD0103 6 μ M 时抑制活性达到最高状态, 在 HCT116 细胞中 MGCD0103 最高抑制全部酶活的 75%, 而 NVP-LAQ824 抑制几乎达到 100%。MGCD0103 抑制 A549 细胞时也显示出剂量依赖性。			
体内研究	在裸鼠中, MGCD0103 明显抑制人类移植瘤的生长, 及抑制肿瘤中组蛋白乙酰化诱导的的相关抗癌活性。MGCD0103 每天口服处理携带移植的晚期 A549 肿瘤的裸鼠, 13 天后, 明显降低生长, 这种作用存在剂量依赖性。MGCD0103 与对照组相比, 明显阻断肿瘤生长, 且体重没有改变。此外, MGCD0103 不会使 WBC 数降低, 且耐受性很好。MGCD0103 作用于许多 其他人类移植瘤模型包括 NSCLC H1437, 是口服有效的。MGCD0103 按 80 mg/kg 剂量每天口服给药携带 H1437 肿瘤的动物, 13 天后, 完全抑制肿瘤生长, 且动物体重没有下降。 [1]MGCD0103 降低肺动脉高血压症的效果比 tadalafil 好, tadalafil 是治疗肺动脉高血压症的常规法, 是一种血管舒张药。此外, MGCD0103 提高肺动脉加速时间, 且降低肺动脉的收缩, 说明 HDAC 抑制剂作用于肺血管具有很好效果。			

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)

MB3722	罗米地辛; Romidepsin
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。MGCD0103 能有效抑制 9 种人重组 hdac 的一个子集, 包括 HDAC1、HDAC2、HDAC3 和 HDAC11。MGCD0103 在体外对人 HDAC1 和 HDAC2 酶的抑制活性最强, 对第二类 HDACs 无抑制作用。抑制活动在 6 μ M MGCD0103 达到最大的高原, 和最大的制约酶池受到 MGCD0103 总数的 75% 在 HCT116 细胞酶活性。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
		2.5224 mL	12.6122 mL	25.2245 mL
1 mM				

5 mM	0.5045 mL	2.5224 mL	5.0449 mL
10 mM	0.2522 mL	1.2612 mL	2.5224 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>体外 HDAC 酶实验: 根据均相荧光释放法进行脱乙酰化酶活性测定。在实验 buffer (包括 25 mM HEPES, pH 为 8.0, 137 mM NaCl, 1 mM MgCl₂, 2.7 mM KCl) 中, 纯化的重组 HDAC 酶和稀释成不同浓度的 MGCD0103 一起在室温下温育 10 分钟。加入底物 Boc-Lys(ε-Ac)-AMC, 在 37°C 进一步温育。作用于不同亚型 HDAC 酶则底物浓度和温育时间都不同。加入胰蛋白酶室温下温育 20 分钟, 脱乙酰化底物释放荧光。在 360, 470, 435 nm 波长处测定荧光信号。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: 人类乳腺上皮细胞(HMEC)和人类包皮成纤维细胞(MRHF) Concentrations: 0-60 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 人类乳腺上皮细胞(HMEC)和人类包皮成纤维细胞(MRHF)接种在 96 孔板上, 加入不同浓度 MGCD0103, 在含 5% CO₂ 环境 37°C 下温育 72 小时。加入 3-(4,5-二甲基-2-噻唑基)-2,5-二苯基溴化四唑 (MTT), 最终浓度为 0.5 mg/ml, 和细胞一起温育 4 小时, 然后加入同体积溶解 buffer,buffer 包含 50% N,N-二甲基甲酰胺,及 20% SDS(pH 为 4.7)。温育过夜, 在 630 nm 处标记, 在 570 nm 处读数, 测量溶解的染料。根据相关细胞系的标准生长曲线计算细胞的吸光值。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 携带 H1437 肿瘤的雌性 CD-1 裸鼠 Formulation: MGCD0103 溶解在用 0.1 M HCl 或 PEG400/0.2 M HCl 盐按 40 : 60 酸化的 PBS 溶液中 Dosages: 80 mg/kg Administration: 口服处理</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。