

JNJ-26481585

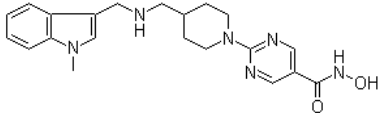
产品编号: MB3740

质量标准: >98%, HDAC 抑制剂

包装规格: 5MG;25MG

产品形式: 粉状

基本信息

分子式	C21H26N6O2	结 构 式	
分子量	394.47		
CAS No.	875320-29-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	10 mM in DMSO		
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: Quisinostat (JNJ-26481585)是有口服活性, 高效的 HDAC 抑制剂。

别名: JNJ-26481585; 5-Pyrimidinecarboxamide,

N-hydroxy-2-[4-[[[(1-methyl-1H-indol-3-yl)methyl]amino]methyl]-1-piperidinyl]-

物理性状及指标:

外观:淡黄或黄色粉末

溶解性:10 mM in DMSO

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	Quisinostat (JNJ-26481585)是有口服活性, 高效的 HDAC 抑制剂, 对 HDAC1 的 IC ₅₀ 值为 0.11 nM。							
靶点	HDAC1	HDAC2	HDAC11	HDAC10	HDAC5	HDAC8	HDAC3	
	0.11 nM (IC ₅₀)	0.33 nM (IC ₅₀)	0.37 nM (IC ₅₀)	0.46 nM (IC ₅₀)	3.69 nM (IC ₅₀)	4.26 nM (IC ₅₀)	4.86 nM (IC ₅₀)	
靶点	HDAC9	HDAC6	HDAC7					
	32.1 nM (IC ₅₀)	76.8 nM (IC ₅₀)	119 nM (IC ₅₀)					
体内研究	Quisinostat 以纳摩尔浓度对广泛的癌细胞系 (包括肺癌, 结肠癌, 乳腺癌, 前列腺癌和卵巢癌细胞系) 发挥广谱抗增殖活性。 JNJ-26481585 显示对所有测试的 HDAC 酶的活性, 在体外观察到重组 HDAC1 的最高效力 (IC ₅₀ , 0.11±0.03 nM), 这与从肿瘤细胞中观察到的 HDAC1 免疫沉淀复合物的效力相当 (IC ₅₀ , 0.16±0.02 nM)。 对 HDAC6,7 和 9 观察到最低的体外效力							

	(IC50,32.1-119nM)。
体外研究	JNJ-26481585 在体内诱导肿瘤组织中的连续 H3 乙酰化。JNJ-26481585, 一种“第二代” HDAC 抑制剂, 在体内具有延长的药效学反应。与该假设一致, 与临床前肿瘤模型中的标准护理剂和第一代 HDAC 抑制剂相比, JNJ-26481585 显示出优异的功效。这些研究表明具有连续药效学活性的 HDAC 抑制剂可能在实体瘤恶性肿瘤中显示出活性。

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)

MB4764	PCI-34051
MB6006	Pracinostat (SB939)
MB3565	Quisinostat (JNJ-26481585) 2HCl

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。Quisinostat (JNJ-26481585)是有口服活性, 高效的 HDAC 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质量	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.5350 mL	12.6752 mL	25.3505 mL
5 mM		0.5070 mL	2.5350 mL	5.0701 mL
10 mM		0.2535 mL	1.2675 mL	2.5350 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	将 JNJ-26481585 作为 5mM 储备溶液溶解在 DMSO 中, 并用合适的培养基稀释。将人 A2780 卵巢肿瘤细胞 (107 细胞/小鼠) 皮下注射。进入雄性无胸腺 nu / nu CD-1 小鼠的腹股沟区域。当获得可触知的肿瘤时, 每天用载体 (10%羟丙基-β-环糊精) 或 JNJ-26481585 以 10mg / kg ip 处理小鼠一次, 并且在指定时间在第 1 天和第 7 天收获肿瘤和血浆。分 (5 只小鼠/点)。使用定量 ELISA (300ng 肿瘤蛋白/孔) 测定 AcH3 的水平, 并基于间接响应药效学模型进行描述。
-------------	--

【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。