

## MC1568

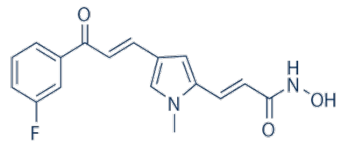
产品编号：MB3741

质量标准：>98%，选择性 HDAC 抑制剂

包装规格：10MG;25MG

产品形式：粉状

### 基本信息

分子式	C17H15FN2O3	结 构 式	
分子量	314.31		
CAS No.	852475-26-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：13 mg/mL (41.36 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：**MC1568 是组蛋白脱乙酰酶(HDAC II)的抑制剂，可用于癌症研究。

### 别名：

3-[5-(3-(3-Fluorophenyl)-3-oxopropen-1-yl)-1-methyl-1H-pyrrol-2-yl]-N-hydroxy-2-propenamide

### 物理性状及指标：

外观：.....粉红色至红色粉末

溶解性：.....DMSO：13 mg/mL (41.36 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

<b>产品描述</b>	MC1568 是一种选择性的 HDAC 抑制剂，作用于玉米 HD1-A，无细胞试验中 IC50 为 100 nM，作用于 HD1-A 比作用于 HD1-B 选择性高 34 倍。	
<b>特性</b>	MC1568 是新型 HDAC 选择性抑制剂。	
<b>靶点</b>	HD1-A (Maize) (Cell-free assay)	HD1-B (Maize) (Cell-free assay)
	100 nM	3.4 μM
<b>体外研究</b>	MC1568 是 II 型选择性组蛋白去乙酰化酶 (IIa) 抑制剂，IC50 为 220 nM，且选择性比 I 型高 176 倍。MC1568 作用于人类乳腺癌 ZR-75.1 细胞裂解物，不抑制 HDAC1，但是抑制 HDAC4。MC1568 (20 μM) 作用于 MCF-7 细胞，增强乙酰化 H3 和 H4 组蛋白的累积，和乙酰基微管蛋白的水平，说明 MC1568 可抑制 HDAC6。MC1568 (5 μM) 作用于 C2C12 细胞，通过降低肌细胞增强因子 2D (MEF2D) 的表达，稳定 HDAC4-HDAC3-MEF2D 复合体，和抑制分化诱导的 MEF2D 乙酰化，从而阻止肌细胞生成。MC1568 (5 或 10 μM) 干扰 RAR 和 PPARγ 调节的分	

	化诱导信号通路。 MC1568 作用于 F9 细胞, MC1568 特定抑制内胚分化, 不影响 V <sub>A</sub> 诱导的早幼粒 NB4 细胞的成熟。 MC1568 作用于 3T3-L1 细胞,降低 PPAR $\gamma$ 诱导的脂肪生成。
<b>体内研究</b>	MC1568 按 50 mg/kg 剂量作用于鼠内, 明显抑制组织选择性 HDAC。 MC1568 作用于骨骼肌和心脏, 抑制 HDAC4 和 HDAC5 的活性, 不影响 HDAC3 活性, 因此 MEF2-HDAC 复合体处于未激活状态。 MC1568 按 50mg/kg 剂量作用于报道的 PPRE-Luc 鼠, 损害 PPAR $\gamma$ 信号, 主要在心脏和脂肪组织部位。在最新胰腺移植研究中, MC1568 增强内分泌 $\beta$ 和 $\delta$ -cells 细胞, 也增强 Pax4 的表达, Pax4 是 $\beta$ 和 $\delta$ 细胞分化所需的一个关键因子。

**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
MB6006	Pracinostat (SB939)

**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。 MC1568 是组蛋白脱乙酰酶(HDAC II)的抑制剂, 可用于癌症研究。

**储液配置**

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.1816 mL	15.9079 mL	31.8157 mL
5 mM	0.6363 mL	3.1816 mL	6.3631 mL
10 mM	0.3182 mL	1.5908 mL	3.1816 mL
50 mM	-	-	-

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	玉米 HD2, HD1-B,和 HD1-A 酶抑制: 酶使氘化的乙酸从底物中释放, 使用闪烁计数器计数。 IC50 值取自三次平行测定的结果。 50 $\mu$ L 玉米酶样本 10 $\mu$ L 全部[3H]醋酸盐预标记的鸡网状细胞组蛋白(2 mg/mL)在 30oC 下反应 30 分钟。加入 50 $\mu$ L 1 M HCl/0.4 M 乙酸盐和 800 $\mu$ L 乙酸乙酯终止反应。 1 $\times$ 10 <sup>4</sup> g 转速离心 5 分钟, 600 $\mu$ L 上相在 3 mL 液体闪烁计数板上测定放射性。 MC1568 按初始浓度 40 $\mu$ M 测定, 后续再稀释。 NaB, VPA, TSA, SAHA, 85TPX, HC-toxin, 和 tubacin 作为参考物, 空白溶剂作为阴性对照。
<b>细胞实验</b>	Cell lines: 3T3-L1 细胞 Concentrations: 5 或 10 $\mu$ M, 溶于 DMSO. Incubation Time: 8 天 Method: 使用异丁基甲基黄嘌呤, Dexamethasone, 和胰岛素促进 3T3-L1 细胞增殖分化。 细胞铺满第二天, 在 8 天的分化期中, 3T3-L1 细胞按如下处理: (1)不处理: 细胞铺满后, 在 8 天的分化期中, 细胞用 DMSO 或 MC1568 处理。 (2)用 Troglitazone 处理: 细胞铺满后, 在 8 天的分化期中, 细胞用 5 $\mu$ M Troglitazone, 或 MC1568, 或两者一起处理。 (3)用 Rosiglitazone 处理: 细胞铺满后, 在 8 天的分化期中, 细胞用 1 $\mu$ M Rosiglitazone 和 DMSO 或 MC1568 处理。 (4)用 Rosiglitazone 和 Dexamethasone 处理: 细胞铺满后, 细胞用 1 $\mu$ M Rosiglitazone 和 390ng/mL Dexamethasone 处理, 在 8 天的分化期中, 细胞用 1 $\mu$ M

	Rosiglitazone 和 DMSO 或 MC1568 处理。所有的培养基在第二天更换。
动物实验	<p>Animal Models: PPRE-Luc 转基因鼠(C57BL/6)</p> <p>Formulation: 溶于含 0.5% carbosimetil 纤维素的水溶液中</p> <p>Dosages: 50 mg/kg</p> <p>Administration: 每天饲喂一次</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。