

## LAQ824 ; Dacinostat ; 达诺司他

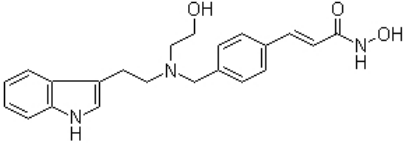
产品编号 : MB3743

质量标准 : >98% , HDAC 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : 粉状

### 基本信息

分子式	C22H25N3O3	结 构 式	
分子量	379.45		
CAS No.	404951-53-7		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 76 mg/mL (200.28 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 :** Dacinostat 是一种有效的 HDAC 抑制剂, Dacinostat 同时可抑制 HDAC1 的活性, 主要用于癌症研究。

**别名 :** NVP-LAQ824; LAQ824 ; 2-Propenamido,

N-hydroxy-3-[4-[[[(2-hydroxyethyl)[2-(1H-indol-3-yl)ethyl]amino]methyl]phenyl]-, (2E)-

### 物理性状及指标 :

外观 : .....淡黄或黄色粉末

溶解性 : .....DMSO : 76 mg/mL (200.28 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>	达诺司他是新型 HDAC 抑制剂, IC50 为 32 nM, 且激活 p21 启动子。
<b>靶点</b>	HDAC
<b>IC50</b>	32 nM
<b>体外研究</b>	在体外, LAQ824 抑制 H1299 细胞裂解液中的人 HDAC 活性, IC50 为 32 nM。此外, LAQ824 通过激活 p21 启动子, 也激活编码 p21 细胞周期抑制剂的基因表达, 最大启动子活性 (AC50) 为 50% 时, 浓度为 0.30 μM。处理 72 小时后, LAQ824 抑制 H1299 (一种非小细胞肺癌细胞) 和 HCT116 (一种结肠癌细胞) 细胞生长, IC50 分别为 0.15 μM 和 0.01 μM, LAQ824 的抗增殖效果选择性作用于肿瘤细胞系。而且, LAQ824 作用于 A549 细胞, 促进 p21 蛋白增多, 这种作用存在剂量依赖性, 且提高 Rb 肿瘤抑制基因的次磷酸化状态。最新研究显示 LAQ824 在 IL-10 基因启动子水平诱导染色体变化, 导致转录抑制剂 HDAC11 和 PU.1 需求增加, 且抑制 BALB/c 巨噬细胞中 IL-10 产量。
<b>体内研究</b>	LAQ824 按 100 mg/kg 剂量作用于携带 HCT116 和人结肠癌移植瘤的裸鼠, 抑制肿瘤生长, 且

	无细胞毒性，这种作用存在剂量依赖性。
<b>特征</b>	LAQ824 是非常有效的组蛋白脱乙酰基酶抑制剂。

**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
MB3741	MC1568
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。Dacinostat 是一种有效的 HDAC 抑制剂，Dacinostat 同时可抑制 HDAC1 的活性，主要用于癌症研究。

**储液配置**

浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6353 mL	13.1767 mL	26.3533 mL
5 mM	0.5271 mL	2.6353 mL	5.2707 mL
10 mM	0.2635 mL	1.3177 mL	2.6353 mL
50 mM	0.0527 mL	0.2635 mL	0.5271 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>体外组蛋白脱乙酰基酶实验：</b> 通过离子交换层析，使用 Q 琼脂糖快速流动柱，使 HDAC 酶部分从 H1299 细胞溶解物中纯化。通过与 cdk2 多克隆抗体 或 cdk1/cdc2 单克隆抗体进行免疫沉淀反应，从 500 mg 全部细胞溶解物中收集酶复合物。免疫沉淀物再悬浮在激酶 buffer (50 mM Hepes, pH 8, 10 mM MgCl<sub>2</sub>, 2.5 mM EDTA, 1 mM 二硫苏糖醇, 20 mM ATP, 10 mM β-甘油磷酸, 0.1 mM NaVO<sub>4</sub>, 1 mM NaF, 50 mM ATP, 10 μCi [γ-<sup>32</sup>P]ATP),及 1 μg pRb 重组蛋白底物(cdk2)或含 20 μg 底物(cdc2)到的 10 mL H1 组蛋白混合物。电泳分析磷酸化的 Rb 和 H1 组蛋白，然后使用 PhosphorImager 量化。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> H1299, HCT116, DU145, PC3 和 MDA435 <b>Concentrations:</b> 0 到 10 μM <b>Incubation Time:</b> 48 小时 <b>Method:</b> 通过 3-MTS 实验测定细胞增殖。然后进行 CellTiter 96 AQueous 非放射性细胞增殖实验。取每组实验的平均值。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 在右腋区皮下注射 HCT116 细胞的远系繁殖系无胸腺(nu/nu)雌鼠 <b>Formulation:</b> 溶于 DMSO <b>Dosages:</b> ≤100 mg/kg <b>Administration:</b> 静脉注射</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。