

Tubastatin A

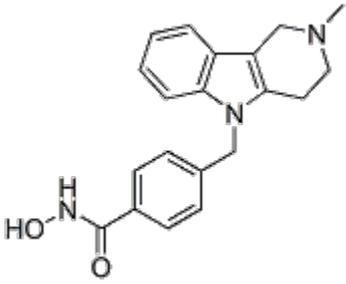
产品编号：MB3745

质量标准：>98%，选择性 HDAC6 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C20H21N3O2	结 构 式	
分子量	335.4		
CAS No.	1252003-15-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：67 mg/mL (199.76 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：Tubastatin A 是一种有效的，选择性的 HDAC6 抑制剂，对其选择性是对 HDAC8 的 57 倍多，是其他同工酶的 1000 多倍。

别名：Benzamide,

N-hydroxy-4-[(1,2,3,4-tetrahydro-2-methyl-5H-pyrido[4,3-b]indol-5-yl)methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：67 mg/mL (199.76 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	Tubastatin A 是有效的，选择性 HDAC6 抑制剂，IC50 为 15 nM，选择性作用于所有其他同工酶(1000 倍) 除了 HDAC8(57 倍)。
靶点	HDAC6 (Cell-free assay)
IC50	15 nM
体外研究	Tubastatin A 选择性作用于所有同工酶除了 HDAC8 对所有亚型不含 HDAC8 保持超过 1000 倍的选择性，对 HDAC8 具有约 57 倍的选择性。2.5 μM Tubastatin A 优先诱导 α-tubulin 高度乙酰化。10 μM Tubastatin A 轻微诱导组蛋白乙酰化。Tubastatin A 5 μM 开始对同型半胱氨酸诱导的神经元细胞死亡具有保护作用，这种作用具有剂量依赖性，10 μM 时，达到完全保护。Tubastatin A (10 μM) 作用于胆管癌细胞系，诱导乙酰化的 α-tubulin 水平增加，和初级纤毛表达的恢复，初级纤毛表达的恢复与下调 Hedgehog (Hh)和 MAPK 信号通路，以及减少细胞增殖率(平均 50%)和浸润(40%)相关。Tubastatin A 作用于 LPS 刺激的人类 THP-1 巨噬细胞，显著抑制 TNF-α 和 IL-6，IC50 分别为 272 nM 和 712 nM。Tubastatin A 作用于小鼠 Raw 264.7 巨噬细胞，抑制一氧化氮(NO)分泌，这种作用具有剂量依赖性，IC50 为

	4.2 μ M。
体内研究	<p>Tubastatin A 降低体内胆管癌的生长。Tubastatin A(10 mg/kg)处理同基因大鼠原位胆管癌模型，诱导低于平均瘤重 6 倍，降低肿瘤重量与肝脏重量和体重（分别为 5 和 5.6 倍）的比值。Tubastatin A 处理肿瘤，与对照组相比，显著降低 PCNA 阳性细胞的量(34% vs 65%)。</p> <p>Tubastat A 按 30 mg/kg 剂量腹腔注射给药弗氏完全佐剂 (FCA) 诱导的动物炎症模型，显著抑制鼠爪体积。Tubastat A(30 mg/kg 腹腔注射)处理胶原诱导型关节炎 DBA1 小鼠的爪子组织，显著降低临床评分 (\sim70%)，和 IL-6 表达。</p>

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)

MB2216	Rocilinostat (ACY-1215)
MB7583	Tubastatin A HCl

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。Tubastatin A 是有效的，选择性 HDAC6 抑制剂，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
1 mM	2.9815 mL	14.9076 mL	29.8151 mL
5 mM	0.5963 mL	2.9815 mL	5.9630 mL
10 mM	0.2982 mL	1.4908 mL	2.9815 mL
50 mM	0.0596 mL	0.2982 mL	0.5963 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>HDAC 酶试验：</p> <p>Tubastatin A 在实验 Buffer(50 mM HEPES, pH 7.4, 100 mM KCl, 0.001% Tween-20, 0.05% BSA, 和 20 μM tris(2-carboxyethyl)phosphine) 中溶解和稀释到终浓度的 6 倍。HDAC 酶在实验 Buffer 中稀释到终浓度的 1.5 倍，与 Tubastatin A 预温育 10 分钟，然后加入底物。通过滴定曲线测得，用于每种酶的 FTS(HDAC1, HDAC2, HDAC3, 和 HDAC6) 或 MAZ-1675 (HDAC4, HDAC5, HDAC7, HDAC8, 和 HDAC9)量等于米氏常数(K_m)。使用 0.3 μM 测序级胰蛋白酶将 FTS 或 MAZ-1675 在实验 Buffer 中稀释到终浓度的 6 倍。底物/胰蛋白酶混合物加入到酶/化合物混合物中，震荡实验板 60 秒，然后置于 SpectraMax M5 酶标仪上。赖氨酸侧链在肽底物中脱乙酰化后，监测酶促反应的 7-amino-4-methoxy-coumarin 释放，监测 30 分钟，计算反应的线性速率。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: 人体胆管癌细胞系 HuCCT-1</p> <p>Concentrations: \sim10 μM</p> <p>Incubation Time: 21 天</p> <p>Method:</p> <p>细胞生长在软琼脂中，测评锚定非依赖性生长。约 25,000 个细胞悬浮在培养基的 0.4% 琼脂中，超过 1% 琼脂层在 6 孔板中。每周加入两次培养基，温育 21 天，拍摄图片。使用 Gel-Pro 软件分析菌落的数量和尺寸。</p>

动物实验：	<p>Animal Models: 携带胆管癌移植瘤 BDEneu 的大鼠</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 10 mg/kg</p> <p>Administration: 每天腹腔注射</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。如需制备储备液，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。