

## RGFP966

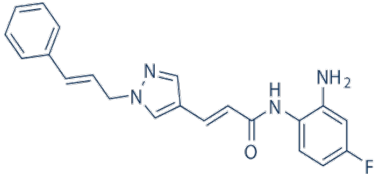
产品编号：MB3746

质量标准：>98%，HDAC 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>19</sub> N <sub>4</sub> O	结 构 式	
分子量	362.4		
CAS No.	1396841-57-8		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO：72 mg/mL (198.67 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：**RGFP966 是组蛋白去乙酰化酶 3 (HDAC3) 的选择性抑制剂。

**别名：**(E)-N-(2-amino-4-fluorophenyl)-3-(1-cinnamyl-1H-pyrazol-4-yl)acrylamide, RGFP 966

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：72 mg/mL (198.67 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20℃，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	RGFP966 是一种 HDAC3 抑制剂，无细胞试验中 IC <sub>50</sub> 为 0.08μM，比作用于其他 HDAC 选择性高 200 倍以上。
<b>靶点</b>	HDAC3 (Cell-free assay) 80 nM
<b>体外研究</b>	RGFP966 是作用缓慢的竞争性紧密结合的 HDAC 抑制剂，抑制 HDAC3 的 IC <sub>50</sub> 为 0.08 μM，而在浓度高达 15 μM 时，对任何其它的 HDAC 无有效抑制。在 2 种 CTCL 细胞系中，RGFP966 处理 24 小时后免疫印迹分析，结果表明 H3K9/K14, H3K27 和 H4K5 的乙酰化增加，而 H3K56ac 没有。RGFP966 降低 CTCL (皮肤 T 细胞淋巴瘤) 细胞生长，是由于细胞凋亡增加，这是与 DNA 损伤有关的和受损的 S 期相关联。RGFP966 导致药物治疗的第一个小时内显著减少 DNA 复制叉的速度。
<b>体内研究</b>	RGFP966 治疗 (10 毫克/千克) 增强长期记忆。RGFP966 (3 或 10 毫克/公斤，皮下注射) 有利于灭绝和防止可卡因条件性位置偏爱复发。

**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)**

MB4763	<a href="#">Givinostat (ITF2357)</a>
MB3740	<a href="#">JNJ-26481585</a>

MB3550

[LMK235](#)

**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。RGFP966 是组蛋白去乙酰化酶 3 (HDAC3) 的选择性抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

体 积 浓 度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7594 mL	13.7969 mL	27.5938 mL
5 mM	0.5519 mL	2.7594 mL	5.5188 mL
10 mM	0.2759 mL	1.3797 mL	2.7594 mL
50 mM	0.0552 mL	0.2759 mL	0.5519 mL

#### 经典实验操作 (仅供参考)

<b>激酶实验:</b>	去乙酰化分析: 去乙酰化分析是基于同质荧光释放法。纯化的重组酶是在图中所指示的浓度梯度抑制剂孵育, 预温育时间从 0 到 3 个小时, 在标准的 HDAC 缓冲液中进行。乙酰基-赖氨酸(AC)-AMC 底物 (在 10 $\mu$ M, 对应于 HDAC1 和 HDAC3 的 Km 值) 在预温育之后加入。该反应运行 1 小时。胰蛋白酶在 5mg/ml 的终浓度, 在 1 小时后加入, 然后荧光发射并用 Tecan M20096 孔读板器测定。
<b>细胞实验:</b>	Cell lines: HH 和 Hut78 CTCL 细胞系 Concentrations: ~10 $\mu$ M Incubation Time: 24 到 72 小时 Method: 细胞计数并分在 T25 (Corning) 培养瓶中, 密度是 26105 个细胞/ mL。然后将细胞用 DMSO 或 HDIs 在 0 小时处理一次。100ml 的等分试样从每个培养瓶中取出, 一式三份, 在处理 0 小时, 24 小时, 48 小时, 和 72 小时后取出并分到 96 孔板中, 10 毫升阿尔玛蓝加入到每个孔中。孵育 4 小时后, 荧光使用 Biotek Synergy MX 酶标仪测定。
<b>动物实验:</b>	Animal Models: 小鼠 Formulation: 溶解于 DMSO 中并稀释于 30% (重量/体积) 的羟丙基- $\beta$ -环糊精和 100mM 的醋酸钠 (pH 值 5.4)。 Dosages: 10 毫克/千克, 10.0 毫升/千克 Administration: 皮下注射

#### 【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。