

NSC 23766; NSC23766

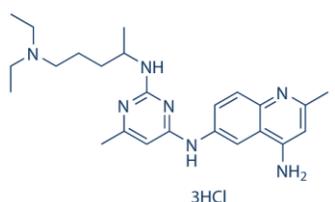
产品编号: MB3840

质量标准: >98%,BR

包装规格: 10MG; 50MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₃₅ N ₇ ·3HCl	结构式	
分子量	530.96		
CAS No.	1177865-17-6		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 106 mg/mL (199.64 mM)		
	Water 106 mg/mL (199.64 mM)		
	Alcohol 5 mg/mL (9.42 mM)		
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: NSC 23766 是一种 **Rac GTPase** 抑制剂, 通过鸟嘌呤核苷酸因子(GEFs)靶向作用于 Rac 活化, 无细胞试验中 **IC₅₀** 为~50 μM; 但是不会抑制密切相关的靶点, Cdc42 或 RhoA。

别名: N6-[2-[[4-(Diethylamino)-1-methylbutyl]amino]-6-methyl-4-pyrimidinyl]-2-methyl-4,6-quinolinediamine trihydrochloride

物理性状及指标:

外观:白色至卡其色固体

溶解性:DMSO 106 mg/mL (199.64 mM); Water 106 mg/mL (199.64 mM); Alcohol 5 mg/mL (9.42 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	NSC 23766 是一种 Rac GTPase 抑制剂, 通过鸟嘌呤核苷酸因子(GEFs)靶向作用于 Rac 活化, 无细胞试验中 IC₅₀ 为~50 μM; 但是不会抑制密切相关的靶点, Cdc42 或 RhoA。	
靶点	Rac GTPase (Cell-free assay)	

	50 μM
体外研究	<p>NSC23766 被认为可以融入 Rac1 的表面沟槽, Rac1 对 GEF 规格至关重要。NSC23766 通过 Rac 特异性的 GEF Trio 或 Tiam1, 有效地抑制 Rac1 结合和激活, 这种作用具有剂量依赖性, 通过其各自的 GEFs, 不干扰紧密相关的 Cdc42 或 RhoA 结合或激活。NSC23766 有效调节细胞骨架中的 Rac GTPase 功能, 和许多细胞功能, 包括细胞周期, 细胞生长, 粘附, 迁移和基因转录。NSC 23766 (50 μM) 作用于 NIH 3T3 细胞, 有效抑制血清或血小板衍生的生长因子诱导的 Rac1 激活和伪足形成, 不影响内源性 Cdc42 或 RhoA 活性。NSC23766 降低 Trio 或 Tiam1 而不是 Vav, Lbc, Intersectin, 和组成型激活的 Rac1 突变型刺激的 NIH 3T3 细胞生长, 也抑制 Trio, Tiam1, 或 Ras 诱导的细胞转化。NSC23766 抑制 PC-3 细胞增殖和锚定非依赖性生长, 这种作用存在剂量依赖性。25 μM NSC23766 抑制 85% PC-3 细胞侵袭穿过基底膜。50 μM NSC 23766 作用于人体血小板, 抑制凝血酶诱导的 Rac1 和 Rac2 激活, 以及血小板聚集。NSC23766 作用于 swAPP-HEK293 细胞, 抑制 Aβ40 和 Aβ42 产生, 不影响 Notch 和 sAPPα。NSC23766 抑制细胞中 γ-分泌酶活性, 但是不是作为直接的 γ-分泌酶抑制剂。NSC23766 降低分泌的和细胞内的 Aβ40 水平, IC50 为 48.94 μM, 这种作用具有剂量依赖性。50 μM NSC 23766 抑制 57.97% Aβ42 释放。NSC23766 调节内皮 NO 合酶表达和内皮功能。100 μM NSC23766 抑制 eNOS 启动子活性, 牛主动脉内皮细胞中抑制 60%, bEND.3 细胞中抑制 30% 至 35%。NSC23766 抑制 Rac1, 破坏 eNOS mRNA 稳定性, 半衰期缩短到 17 小时。NSC23766 抑制 ACh 诱导的野生型小鼠主动脉环放松, 这种作用存在剂量依赖性。NSC23766 抑制细胞生长, 且诱导细胞凋亡。NSC23766 降低 MDA-MB-468 和 MDA-MB-231 细胞活力, 这种作用存在剂量依赖性, IC50 为 ~10 μM, 与雌激素受体 (ER), 孕酮受体 (PR), Her2, 和 p53 基因突变状态无关。NSC23766 对 MCF12A 正常乳腺上皮细胞的存活几乎没有影响。NSC 23766 处理 MDA-MB-231 细胞 24 小时后, G1 期细胞增长 41% 至 65%, S 和 G2-M 期随之减少。100 μM NSC23766 诱导 MDA-MB-468 细胞凋亡增长 6 倍。NSC23766 作用于乳腺癌细胞, 抑制细胞周期停滞或凋亡, 通过下调 cyclin D1, survivin, X-连锁蛋白凋亡抑制剂 (XIAP) 而调节。</p>
体内实验	<p>NSC23766 诱导造血干细胞/前体细胞动员。NSC23766 按 2.5 mg/kg 剂量腹腔注射到驱动不良的 C57Bl/6 小鼠品系, 注射 6 小时后, 导致循环中的造血干细胞/前体细胞增强 2 倍。NSC23766 处理小鼠, 减轻脂多糖诱导的急性肺损伤。NSC23766 按 1 或 3 mg/kg 剂量处理, 不仅降低炎性细胞浸润和 MPO 活性, 也抑制促炎介质, 和肿瘤坏死因子-α, 白细胞介素-1β, mRNA 表达。NSC23766 也降低 Evans Blue 和清蛋白在 LPS 处理的肺部积累。</p>

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。本品 NSC 23766 是一种 Rac GTPase 抑制剂, 通过鸟嘌呤核苷酸因子(GEFs)靶向作用于 Rac 活化, 可用于相关领域的科研实验。

储液配置

浓度	质量 / 体积			
	DMSO	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		1.8834 mL	9.4169 mL	18.8338 mL
5 mM		0.3767 mL	1.8834 mL	3.7668 mL
10 mM		0.1883 mL	0.9417 mL	1.8834 mL
50 mM		0.0377 mL	0.1883 mL	0.3767 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	Rho GTPase 活性测定: 10-cm 培养皿中的对数生长期细胞生长在 0.5% 血清培养基中饥饿处理 24 小时，然后溶解在含 20 mM Tris HCl (pH 7.6), 100 mM NaCl, 10 mM MgCl ₂ , 1% Nonidet P-40, 10% 甘油, 和 1x 蛋白酶抑制剂混合物的 Buffer 中。澄清裂解液，蛋白浓度归一化，通过效应结构域下拉检测测量裂解液中与 GTP 结合的 Rac1。His6-PAK1 PBD 下拉实验中，E. coli 纯化的 Ni ²⁺ -琼脂糖固定的 His6-PAK1 PBD 域与细胞裂解液温育 30 分钟。使用 anti-Rac1 单克隆抗体，通过免疫印迹，在洗涤缓冲液中洗涤两次 Ni ²⁺ -琼脂糖共同沉淀。
动物实验	Cell lines: 人类乳腺癌细胞 MDA-MB-468 Concentrations: 0-100 μM Incubation Time: 2 天 Method: 细胞按 1.5×10 ⁴ 个/mL 接种在 96 孔组织培养板中，孔中含 200 μL 培养基。接种 24 小时后，使用含指定浓度 NSC23766 的 200 μL 新鲜培养基置换原来的培养基。处理末期，每孔加入 20 μL MTS 溶液，在 37°C 下温育 2 小时。在 96 孔板酶标仪上读取 490 nm 处吸光值。

【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。如需制备储备液，请选择合适溶剂，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(M ²)	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。