

MS275; SNDX 275; Entinostat (MS-275)

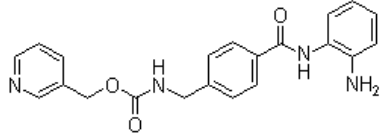
产品编号: MB4065

质量标准: >98%

包装规格: 10MG;50MG;100MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C21H20N4O3	结 构 式	
分子量	376.41		
CAS No.	209783-80-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25℃)	DMSO: 75 mg/mL (199.25 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: Entinostat 是选择性, 可口服的 HDAC 抑制剂。

别名: 恩替诺特; MS-275; SNDX-275; Carbamic acid,

N-[[4-[[[(2-aminophenyl)amino]carbonyl]phenyl]methyl]-3-pyridinyl]methyl ester

物理性状及指标:

外观:白色至淡黄色固体

溶解性:DMSO: 75 mg/mL (199.25 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

产品描述	Entinostat (MS-275)强烈抑制 HDAC1 和 HDAC3, 无细胞试验中 IC50 分别为 0.51 μM 和 1.7 μM, 抑制作用强于 HDACs 4, 6, 8, 和 10。	
靶点	HDAC1 (Cell-free assay)	HDAC3 (Cell-free assay)
	0.51 μM	1.7 μM
体外研究	MS-275 通过作用于 2'-氨基而抑制 HDACs。MS-275 作用于 K562 细胞, 诱导 p21 ^{WAF1/CIP1} 和凝溶胶蛋白的累积。MS-275 作用于 A2780 细胞, 可以降低 S 期细胞, 提高 G1 期细胞。MS-275 通过抑制 HAD 而抑制人类肿瘤细胞系, 包括 A2780, Calu-3, HL-60, K562, St-4, HT-29, KB-3-1, Capan-1, 4-1St 和 HCT-15 细胞增殖, IC50 为 41.5 nM 到 4.71 μM。MS-275 抑制 HDACs, 作用于 HDAC1 和 HDAC3 时 IC50 分别为 0.51 μM 和 1.7 μM。而对其他的 HDACs 没有抑制效果, 如 HDAC4, 6, 8 和 10。MS-275 有效抑制人类白血病和淋巴瘤细胞, 包括 U937, HL-60, K562, 和	

	Jurkat. MS-275 可以诱导 U937 细胞 p21CIP1/WAF1 调节的生长和变异 Marker (CD11b)的表达。MS-275 降低 cyclin D1 和抗凋亡蛋白 Mcl-1 与 XIAP 的表达。
体内研究	MS-275 按 49 mg/kg 剂量作用于除了 HCT-15 的人类移植瘤都显示出强抗癌活性。MS-275 促进恶性实体瘤和恶性血液病的治疗可能性, 及生理和畸变基因表达的调节。MS-275 和 IL-2 联用, 作用于肾细胞癌显示出强抗癌活性, 因为降低调节性 T 细胞和增强脾细胞的表达。

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	Givinostat (ITF2357)
MB3740	JNJ-26481585
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。Entinostat (MS-275)强烈抑制 HDAC1 和 HDAC3, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体质量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6567 mL	13.2834 mL	26.5668 mL
5 mM	0.5313 mL	2.6567 mL	5.3134 mL
10 mM	0.2657 mL	1.3283 mL	2.6567 mL
50 mM	0.0531 mL	0.2657 mL	0.5313 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>标准 HDAC 实验:</p> <p>用 HDAC buffer 按 1:6 稀释鼠肝内的酶。重组人类 HDACs 按 1:4 稀释在 HDAC buffer 中。用于标准 HDAC 实验, 60 μl HDAC buffer 和 10 μl 稀释的酶溶液在 30°C 混合。在 HDAC buffer 中加入 30 μl 基底液开始 HDAC 反应, 随后在 30°C 下温育 30 分钟。加入 100 μl 胰蛋白酶溶液终止反应, 胰蛋白酶溶液由溶于 50 mM Tris-HCl (pH 为 8.0) 的 10 mg/ml 胰蛋白酶, 100 mM NaCl, 及 2 μM TSA 组成。30°C 下温育 20 分钟, 通过测定 460 纳米($\lambda_{ex} = 390$ nm)处的荧光监测 AMC 的释放。使用释放的 AMC 校准荧光强度。用于标准时间过程实验, 在初始 100 μl HDAC 反应中加入 20 pmol 基底物。2-50 pmol 基底物的酶法分析产物获得荧光 AMC, 通过测量这种荧光 AMC 来测定 Km 值和 Vmax 值。使用 Hanes 图分析实验数据。记录的 AMC 信号是针对没有酶而有 buffer 和基底物的空白区。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: A2780, Calu-3, HL-60, K562, St-4, HT-29, KB-3-1, Capan-1, 4-1St 和 HCT-15 细胞</p> <p>Concentrations: 10 μM 左右</p> <p>Incubation Time: 3 天</p> <p>Method: 5\times10³ 个肿瘤细胞接种到 96 孔板上, 加入梯度浓度 MS-275 培养三天。细胞用 0.1 mg/mL 中性红在 CO₂ 反应器中染色 1 小时, 测定中性红与 50 μL 乙醇和 150 μL 0.1 M Na₂HPO₄ 溶解后的 OD540, 测定 IC₅₀ 值。</p>

动物实验	<p>Animal Models: 侧腹皮下注射 A2780, HT-29, HTC-15, KB-3-1, 4-1St, St-4, Capan-1 和 Calu-3 细胞的裸鼠</p> <p>Formulation: 溶于 0.05 N HCl, 0.1% Tween-80</p> <p>Dosages: 12.3, 24.5 和 49 mg/kg</p> <p>Administration: 每天口服处理一次, 每周进行 5 天, 持续 4 周。</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。