

Zosuquidar (LY335979) 3HCl

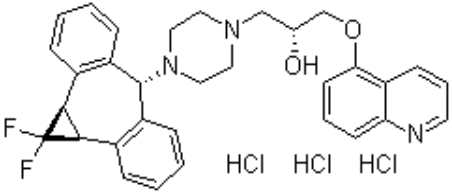
产品编号：MB4259

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C32H31F2N3O2.3HCl	结 构 式	
分子量	636.99		
CAS No.	167465-36-3		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (156.98 mM) Water : 23 mg/mL (36.1 mM) 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：Zosuquidar trihydrochloride 是 P-糖蛋白的抑制剂。

别名：唑喹达三盐酸盐；(2R)-Anti-5-[3-[4-(10,11-difluoromethanodibenzosuber-5-yl)piperazin-1-yl]-2-hydroxypropoxy]quinoline hydrochloride, LY-335979, RS-33295-198

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (156.98 mM) ; Water : 23 mg/mL (36.1 mM) ; 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	Zosuquidar (LY335979) 3HCl 是一种有效的 P-glycoprotein 介导的多药耐抗性的调节剂，无细胞试验中 K_i 为 60 nM。Phase 3。
特性	LY335979 是 P-gp 调节的多耐药有效调节剂。
靶点	P-gp

	(Cell-free assay) 60 nM(Ki)
体外研究	LY335979 竞争性抑制 ^[3H] vinblastine 与 P-gp 的平衡结合, K_i 为 60 nM, 通过阻断 CEM/VLB ₁₀₀ 质膜中 P-gp 的 ^[3H] azidopine 的光亲和标记。LY335979 浓度为 0.1 μM 时, 单独给药对药物敏感的 MDR 细胞系, 具有细胞毒性, IC ₅₀ 为 6 μM-16 μM, 且浓度为 0.5 μM 时, 完全扭转对 MDR 细胞 P388/ADR, MCF7/ADR, 2780AD, 或 UCLA-P3.003VLB 溶瘤细胞抗性(Vinblastine, Doxorubicin, 或 Etoposide)。LY335979 作用于表达 P-gp 的白血病细胞系, 包括 K562/HHT40, K562/HHT90, K562/DOX 和 HL60/DNR, 显著恢复药物敏感性, 且作用于携带活性 P-gp 的原发性 AML 细胞, 增强蒽环类药物(Daunorubicin, Idarubicin, Mitoxantrone)和 gemtuzumab ozogamicin 的毒性。最新文献说明 LY335979 作用于 ABCB1 转导的细胞, 完全抑制(Z)-endoxifen 在顶端调控的运输。

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)

MB7522	Elacridar(GF120918)
MB5462	Tariquidar,XR-9576

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。Zosuquidar trihydrochloride 是 P-糖蛋白的抑制剂。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	1.5699 mL	7.8494 mL	15.6988 mL
5 mM	0.3140 mL	1.5699 mL	3.1398 mL
10 mM	0.1570 mL	0.7849 mL	1.5699 mL
50 mM	0.0314 mL	0.1570 mL	0.3140 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>ATP 酶实验:</p> <p>通过测量从 ATP 中释放的无机磷酸而测量 P-gp ATP 酶活性。在 96 孔板中在 37°C 下进行实验 90 分钟。在有或无 1 mM 钒酸钠存在时, 在含 5 mM 叠氮化钠, 1 mM 乌本苷, 1 mM EGTA, 3 mM ATP, 及 5 mM 磷酸烯醇式丙酮酸和 3.6 单位/mL 丙酮酸激酶 组成的 ATP 再生系统的 buffer A (总体积为 100 μL) 中, 温育膜蛋白 (8 μg-10 μg)。Pgp-ATP 酶活性定义为总 ATP 酶活性中对钒酸盐敏感的部分。加入检测液 3 分钟后, 读数。使用微孔读数器在 690 nm 处测定吸光值。使用磷酸标准曲线测定形成磷酸的 μmol 数。每组样品重复测量三次。</p>
-------------	--

<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: CEM/VLB₁₀₀, P388/ADR, MCF7/ADR, 2780AD, 和 UCLA-P3.OO3VLB.</p> <p>Concentrations: 0.05 μM 到 5 μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 使用修正的 MTT 染料减少法测定细胞活性。收集对数生长期细胞，接种在 96 孔板上。在溶瘤细胞存在时，细胞培养 72 小时。MCF-7 和 MCF-7/ADR 细胞温育 24 小时，然后加入药物。LY335979 制备成 2 nM DMSO 储存液，加到每孔中，终浓度为 0.05 到 5 μM。72 小时后，20 μL 新鲜准备的 MTT 加到每孔中，在 37°C 下含 5% CO₂ 环境下温育 4 小时。细胞在 Sorvall RT6000B 离心机中制成颗粒状，70 μL 培养基小心从每孔中转移，然后加入 100 μL 2-丙醇/0.04 N HCl。使用 Multipipettor 使细胞悬浮 5 到 10 次，直到看不到可见颗粒。然后立刻在 Titertek Multiskan MCC/340 酶标仪流动实验室读数，使用 570 nm 测试波长，630 nm 参考波长。对照组重复测量四次。使用 CeliTiter 96 AQueous 检测试剂盒进行毒性分析。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 腹腔注射 P388 或 P388/ADR 细胞的雌性 BDF₁ 小鼠</p> <p>Formulation: LY335979 溶于 5% 甘露醇</p> <p>Dosages: ≤30 mg/kg</p> <p>Administration: 腹腔注射或静脉注射</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。