

## Zosuquidar 3HCl; LY335979

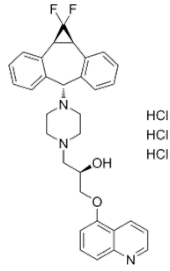
产品编号: MB5147

质量标准: >98%

包装规格: 20MG/100MG/1G

产品形式: 淡黄色至黄色固体粉末

### 基本信息

分子式	C <sub>32</sub> H <sub>34</sub> Cl <sub>3</sub> F <sub>2</sub> N <sub>3</sub> O <sub>2</sub>	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)	Water: 4mg/mL		
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 是一种 P-糖蛋白抑制剂。

**功能与特点:** 该产品为毒药物动力学研究中的特色产品。

**生物活性** (仅来源于公开文献, 供参考)

产品描述	Zosuquidar (LY335979) 是一种有效的 P-糖蛋白介导的多药耐药性调节剂。
靶点	P-gp
体外研究	LY335979 通过阻断 CEM/VLB100 质膜中 Pgp 的 [3H] 叠氮平光亲和标记, 竞争性地抑制 [3H] 长春碱与 Pgp 的平衡结合。单独 LY335979 显示出对药物敏感和 MDR 细胞系的细胞毒性, IC50 范围为 6 μM-16 μM, 并能够完全逆转溶瘤剂 (长春碱、多柔比星或依托泊苷) 对浓度为 0.1 和 0.5 μM 的 MDR 细胞系 P388/ADR、MCF7/ADR、2780AD 或 UCLA-P3.003VLB 的耐药性。LY335979 显著恢复表达 P-gp 的白血病细胞系 (包括 K562/HHT40、K562/HHT90、K562/DOX 和 HL60/DNR) 的药物敏感性, 并增强蒽环类药物 (柔红霉素、伊达比星、米托蒽醌) 和吉妥珠单抗奥佐米星 (Mylotarg) 在具有活性 P-gp 的原发性 AML 原始细胞中的细胞毒性。一篇最新论文表明, LY335979 完全抑制 ABCB1 转导细胞中 (Z)-endoxifen 的顶端定向转运。
体内研究	Zosuquidar trihydrochloride 作为血脑 P-gp 抑制剂仅具有中等活性。口服剂量为 25mg / kg 的三盐酸 Zosuquidar 在紫杉醇给药后 1 小时和 24 小时时脑浓度增加约 2.5 倍。Zosuquidar 以剂量依赖性方式增强奈非那韦的大脑摄取。脑组织/血浆奈非那韦浓度比从没有 zosuquidar 给药时的 0.06±0.03 和静脉注射 2mg / kg 佐舒奎达后 2 至 6 小时之间的 0.09±0.02 增加到 6 小时后的 0.85±0.19 和 20mg / kg 佐舒奎达后的 1.58±0.67。
参考文献	[1] Dantzig AH, et al. Cancer Res. 1996, 56(18), 4171-4179. [2] Tang R, et al. BMC Cancer. 2008, 8,51. [3] Iusuf D, J Pharmacol Exp Ther. 2011, 337(3), 710-717. [4] Kemper EM, et al. The influence of the P-glycoprotein inhibitor zosuquidar trihydrochloride



(LY335979) on the brain penetration of paclitaxel in mice. Cancer Chemother Pharmacol. 2004 Feb;53(2):173-8. [5] Anderson BD, et al. Dependence of nelfinavir brain uptake on dose and tissue concentrations of the selective P-glycoprotein inhibitor zosuquidar in rats. Drug Metab Dispos. 2006 Apr;34(4):653-9.
--

**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。本产品为 P-糖蛋白（P-gp 的，MDR1）有效抑制剂，该转运蛋白质是细胞药物释放的关键调节剂，本产品使血癌（AML）和其他癌细胞株对细胞毒性药物变得敏感。

**储液配制:**

体 积 浓度	质 量 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	--	--	--

**【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。



J240102

