

Tariquidar ; XR-9576

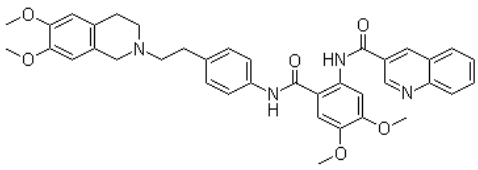
产品编号 : MB5462

质量标准 : >98%,P-糖蛋白抑制剂

包装规格 : 10MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C38H38N4O6	结 构 式	
分子量	646.73		
CAS No.	206873-63-4		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 52 mg/mL (80.4 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 : 他立喹达 Tariquidar 是一种有效的特异性 P-glycoprotein (P-gp)抑制剂。

别名 : XR9576 ; 3-Quinolinecarboxamide, N-[2-[[[4-[2-(3,4-dihydro-6,7-dimethoxy-2(1H)-isoquinolinyl)ethyl]phenyl]amino]carbonyl]-4,5-dimethoxyphenyl]-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 52 mg/mL (80.4 mM) ; Water Insoluble ; 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	Tariquidar (XR9576)是有效的, 选择性的, 非竞争性 P-glycoprotein 抑制剂, Kd 为 5.1 nM, 作用于 MDR 细胞系, 可以逆转耐药性。
靶点	P-glycoprotein
IC50	5.1 nM (Kd)
体外研究	Tariquidar 高亲和力结合到 P-gp, Bmax 为 275 pmol/mg。Tariquidar 与 P-gp 底物

	<p>Vinblastine 和 Paclitaxel 非竞争性地相互作用。Tariquidar 作用于 CHrB30 细胞，增加这些细胞毒素的稳态积累，达到非 P-gp 表达的 AuxB1 细胞中观察的水平，EC50 为 487 nM。Tariquidar 可以抑制 P-gp 的对 Vanadate 敏感的 ATPase 活性，抑制达 60-70%，有效 IC50 值为 43 nM。Tariquidar 高浓度时，可以抑制其他耐药机制。1 μM Tariquidar 在体外，可以废除 ABCG2 (BCRP) 介导的 Camptothecins 耐药性。Tariquidar 增强几种药物的细胞毒性，包括 Doxorubicin, Paclitaxel, Etoposide, 和 Vincristine。处理具有内在耐药性的小鼠结肠癌细胞系 MC26，Doxorubicin 比 0.1 μM Tariquidar (36 vs 7 nM) 的 IC50 值低 5 倍。处理具有获得性化疗抗性的小鼠乳腺癌，人类小细胞肺癌，和人类卵巢癌细胞系(EMT6/AR1.0, H69/LX4 和 2780 AD)，Doxorubicin 比 0.1 μM Tariquidar 的 IC50 值低 22-150 倍。从培养系统除去 Tariquidar 后，P-gp 的抑制作用持续 23 小时。Tariquidar 恢复 Doxorubicin 和 Vinblastine 作用于 MCF7WT 乳腺癌细胞系衍生的多细胞肿瘤球体模型的细胞毒性。</p>
<p>体内研究</p>	<p>Tariquidar(2-8 mg/kg 口服处理)显著增强 Doxorubicin(5 mg/kg, 静脉注射)处理 MC26 小鼠结肠癌的抗肿瘤活性。Tariquidar 和 XR9576(6-12 mg/kg 口服处理)合用共处理人类移植瘤，完全恢复 Paclitaxel, Etoposide, 和 Vincristine 作用于两个高度抗 MDR 的人类移植瘤(2780AD, H69/LX4)的抗肿瘤活性。</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。本品他立隆达 Tariquidar 是一种有效的特异性 P-glycoprotein (P-gp)抑制剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

<p>体 质 浓度 量 积</p>	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.5462 mL	7.7312 mL	15.4624 mL
5 mM	0.3092 mL	1.5462 mL	3.0925 mL
10 mM	0.1546 mL	0.7731 mL	1.5462 mL
50 mM	0.0309 mL	0.1546 mL	0.3092 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<p>激酶实验</p>	<p>稳态药物累积实验: AuxB1 和 CHrB30 细胞在 12 孔(24 mm)组织培养皿中生长至汇合，测量³H-Vinblastine 的稳态累积。加入 0.1 μ Ci ³H-Vinblastine 和未标记的 Vinblastine 开始累积，终浓度为 100 nM。使用 0.1 μ Ci ³H-Paclitaxel 和未标记的药物测量³H-Paclitaxel 的累积，终浓度为 1 μ M。细胞在 37°C 下 5% CO₂ 环境中温育 60 分钟，达到稳态，反应体积为 1 mL。在 10⁻⁹-10⁻⁶ M 浓度范围内 调查调节剂 XR9576 对³H-配体累积的影响。DMSO 储存液中加入调节剂，最终溶剂浓度为 0.2 %(v/v)。细胞收集后，通过液体闪烁计数和归一化细胞蛋白质含量测量累计的</p>
--------------------	--

	药物。
细胞实验	<p>Cell lines: 小鼠乳腺癌细胞系 MDR EMT6/AR1.0</p> <p>Concentrations: ~100 nM Tariquidar</p> <p>Incubation Time: 4 天</p> <p>Method:</p> <p>细胞按每孔 800 个接种在含 100 μL 培养基的 96 孔板中, 在 37°C 下温育 4 小时。随后加入不同浓度的调节剂或溶剂对照 (50μL/孔), 再温育 1 小时, 加入细胞毒性药物。加入细胞毒性药物 (50μL), 每孔按一式四份得到终浓度的范围。再温育 4 天, 通过 Sulforhodamine B 实验测评贴壁细胞的细胞增殖。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带结肠癌移植瘤 MC26 的小鼠</p> <p>Formulation: 5% (w/v) D-(1)-血糖 (葡萄糖) 溶液</p> <p>Dosages: 8 mg/kg</p> <p>Administration: Tariquidar (口服处理) 和 Doxorubicin (5 mg/kg, 静脉注射) 共处理</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, 否则会严重影响化合物活性, 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。