

CUDC-101 ; CUDC101

产品编号 : MB5710

质量标准 : >98%,HDAC,EGFR 和 HER2 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₂₆ N ₄ O ₄	结 构 式	
分子量	434.49		
CAS No.	1012054-59-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 20 mg/mL (46.03 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 : CUDC-101 是一种高效的 HDAC、EGFR 和 HER2 抑制剂。

别名 : Heptanamide, 7-[[4-[(3-ethynylphenyl)amino]-7-methoxy-6-quinazolinyl]oxy]-Nhydroxy

物理性状及指标 :

外观 :白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 20 mg/mL (46.03 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	CUDC-101 是一种有效的, 多靶点抑制剂, 作用于 HDAC, EGFR 和 HER2, IC50 分别为 4.4 nM, 2.4 nM, 和 15.7 nM, 且抑制 I/II 型 HDACs, 但是对 III 型, Sir-type HDACs 没有抑制作用。				
特性	CUDC-101 会同时造成 HDAC 和 RTK 通路的阻断。				
靶点	EGFR (Cell-free)	HDAC (Cell-free)	HDAC1 (Cell-free)	HDAC6 (Cell-free)	HDAC3 (Cell-free)

	assay)	assay)	assay)	assay)	assay)
	2.4 nM	4.4 nM	4.5 nM	5.1 nM	9.1 nM
体外研究	CUDC-101 作为特异性抑制一类和二类 HDACs 家族的抑制剂，不能抑制第三类 HDACs 家族。CUDC-101 还对其他的蛋白激酶包括 KDR/VEGFR2, Lyn, Lck, Abl-1, FGFR-2, Flt-3 和 Ret 具有微弱的抑制活性。IC50 分别是 0.85 μM, 0.84 μM, 5.91 μM, 2.89 μM, 3.43 μM, 1.5 μM 和 3.2 μM。CUDC-101 在很多人癌细胞中表现出广谱的抗增殖活性。IC50 在 0.04μM 到 0.80 μM 之间。在很多癌细胞中，这种活性甚至超过了 erlotinib, lapatinib, 以及 erlotinib 和 lapatinib 与 vorinostat 共同使用时所表现出的抑制活性。CUDC-101 能够抑制具有 lapatinib 和 erlotinib 抗性的癌细胞系的增殖能力。CUDC-101 抑制 erlotinib 抗性的 EGFR 突变型 T790M 细胞系，即使这种抑制效果不是很完全，在其酶活性最高峰是仍不超过 60%。在多种癌细胞系中，CUDC-101 处理不仅能够以剂量依赖的方式增加组蛋白 H3 和 H4 的乙酰化水平，同时也能够使非组蛋白底物 p53 和 α-tubulin 的乙酰化水平升高。CUDC-101 同时还能够抑制肿瘤细胞中 HER3 的表达，Met 的扩增以及 AKT 的重激活				
体内研究	CUDC-101 以 120 mg/kg/天方式给药处理 Hep-G2 肝肿瘤模型能够诱导肿瘤的退化，比 erlotinib 所用的最大耐药剂量(25 mg/kg/天) 以及 vorinostat 等摩尔剂量(72 mg/kg/天)时的抑制效果都要明显有效。CUDC-101 以剂量依赖的方式抑制 erlotinib 敏感的 H358 NSCLC 移植瘤的生长。CUDC-101 也表现出抑制 erlotinib 敏感的 A549 NSCLC 移植瘤生长的能力。CUDC-101 在两个模型中均表现出明显促进肿瘤退化的效果，分别是 lapatinib 敏感，HER2 阴性和 EGFR 过表达的 MDA-MB-468 乳腺肿瘤模型和 EGFR 过表达的 CAL-27 脑颈癌 (HNSCC)模型。CUDC-101 抑制 K-ras 突变的 HCT116 结肠模型和 EGFR/HER2 (neu)表达的 HPAC 胰腺肿瘤模型中肿瘤生长				

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)

MB5709	帕比司他
MB5022	组蛋白去乙酰化酶抑制剂(M 344)
MB7001	Belinostat

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。CUDC-101 是一种高效的 HDAC、EGFR 和 HER2 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
		2.3015 mL	11.5077 mL	23.0155 mL
1 mM				
5 mM		0.4603 mL	2.3015 mL	4.6031 mL

10 mM	0.2302 mL	1.1508 mL	2.3015 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>HDAC, EGFR 和 HER2 抑制效果分析: 一类和二类 HDACs 酶活性是用 HeLa 细胞裂解液通过 Biomol Color de Lys 系统检测的。不用浓度的 CUDC-101 加入到 HeLa 细胞裂解液中检测底物的色度。显影剂最后加入。酶活性用 Wallac Victor II 1420 微型读卡板检测 405 nM 时的峰值。EGFR 和 HER2 的激酶活性是用 HTScan EGF 受体和 HER2 激酶活性检测试剂盒检测的。首先, GST-EGFR 融合蛋白与合成的带有生物素标签的底物多肽孵育。然后加入不同浓度的 CUDC-101 和 400 mM 的 ATP。磷酸化的底物通过 streptavidin 扣板的 96 孔板获得。用抗酪氨酸磷酸化的抗体和钨标签的二抗检测磷酸化的水平。增强液最后加入, 酶活性用 Wallac Victor II 1420 微型读卡板检测 613 nM 时的峰值。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HCC827, H358, H460, HepG2, Hep3B2, Sk-Hep-1, Capan1, BxPc3, MCF-7, MDA-MB-231, 和 Sk-Br-3 细胞 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度 ~10 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 癌细胞按 5000 到 10000 个每孔接种到 96 孔板中并加入不同浓度的 CUDC-101。在含有 0.5% 胎牛血清的培养环境中细胞与 CUDC-101 孵育 72 小时。通过 Perkin-Elmer ATPlite 试剂盒对 ATP 含量进行测定以此来分析细胞的生长抑制情况。利用 Apo-ONE Homogeneous Assay 试剂盒, 按照惯例通过对 Caspase-3 和 7 的活性测量来分析细胞凋亡情况。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 Hep-G2, H358, A549, MDA-MB468, HCT116, CAL-27, HepG2 或 HPAC 细胞的无胸腺雌性小鼠(nude nu/nu CD-1) Formulation: 在 30% Captisol 环糊精溶液中配制 Dosages: ~120 mg/kg/天 Administration: 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。