

Pracinostat ; SB939

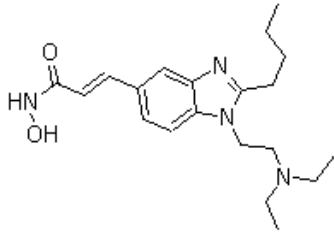
产品编号：MB6006

质量标准：>98%，pan-HDAC 抑制剂

包装规格：5MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C20H30N4O2	结 构 式	
分子量	358.48		
CAS No.	929016-96-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 72 mg/mL (200.84 mM) Water Insoluble Ethanol : 27 mg/mL (75.31 mM)		
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：Pracinostat 是一种有效的组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂，可用于癌症研究。

别名：SB939 ;2-Propenamide, 3-[2-butyl-1-[2-(diethylamino)ethyl]-1H-benzimidazol-5-yl]-N-hydroxy-, (2E)-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 72 mg/mL (200.84 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 27 mg/mL (75.31 mM)

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	Pracinostat (SB939)是一种有效的 pan-HDAC 抑制剂，IC50 为 40-140 nM，除了 HDAC6 例外，对 III 型同工酶 SIRT I 没有抑制活性。				
特性	SB939 是最好的 HDAC 抑制剂，且是 S*Bio Pte 公司的领先候选药。				
靶点	HDAC10 (Cell-free assay)	HDAC3 (Cell-free assay)	HDAC5 (Cell-free assay)	HDAC1 (Cell-free assay)	HDAC4 (Cell-free assay)
	40 nM	43 nM	47 nM	49 nM	56 nM
体外研究	SB939 作用于 III 型同工酶 SIRT I 没有抑制效果。与作用于结肠和前列腺癌细胞系相比，SB939 作用于皮肤 T 细胞淋巴瘤细胞和白血病细胞效果更好，IC50 为 50 nM (H9 皮肤 T 细胞淋巴瘤细胞)到 170 nM (HEL92.1.7 红白血病细胞)。SB939 浓度为 100 μM 对正常人类皮肤成纤维细胞也没有抑制效果。SB939 作用于 HCT-116 细胞，诱导组蛋白 H3 乙酰化，α-tubulin 的乙酰化作用，降低视网膜神经胶质瘤在丝氨酸 807/811 位点磷酸化，且诱导细胞周期停滞。				

体内研究	SB939 作用于裸鼠，比 SAHA 具有更强的药物动力学效果和口服生物有效性。SB939 按 50 mg/kg 剂量处理 HCT-116 移植瘤，选择性刺激肿瘤组织生长。SB939 按 100 mg/kg 剂量处理携带 HCT-116 肿瘤的鼠，肿瘤生长抑制率达 94%。SB939 作用于 APCmin 鼠，抑制腺瘤形成和提高血球密度，效果比 5-氟尿嘧啶好。SB939 作用于肿瘤模型(HCT-116, PC-3, A2780, MV4-11, Ramos)，具有抗癌活性和高效性。SB939 具有较好的吸收，分配，代谢，和分泌等药物属性，且安全。
-------------	---

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)

MB7001	Belinostat
MB3885	CUDC-907
MB4763	Givinostat (ITF2357)

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。Pracinostat 是一种有效的组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂，可用于癌症研究。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.7896 mL	13.9478 mL	27.8956 mL
5 mM	0.5579 mL	2.7896 mL	5.5791 mL
10 mM	0.2790 mL	1.3948 mL	2.7896 mL
50 mM	0.0558 mL	0.2790 mL	0.5579 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>HDAC 酶实验：</p> <p>用于体外研究，SB939 溶于 DMSO (储存浓度为 10 mM)。HDAC 酶实验：I, II, 和 IV 型同工酶实验在 384 孔板上进行，使用荧光 HDAC 活性实验。反应液包括 2.5 或 5 μL HDAC 同工酶, 实验 buffer (25 mM Tris-HCl, pH 为 7.5; 137 mM NaCl; 2.7 mM KCl, 1 mM MgCl₂，和 1 mg/mL BSA)，不同浓度的 SB939 或 DMSO, 及荧光脱乙酰基酶底物 Flour de LysTM，全部反应体积为 33 μL。实验中使用的同工酶不同，则底物浓度也不同(HDAC1 为 1μM，HDACs 2-5 为 250 μM，HDAC6 为 50 μM，HDACs 7-10 为 625 μM)。在室温下温育 2 小时，加入 16 μL Flour de LysTM 显影剂，获得荧光团，而得到乙酰基酶底物。再次温育 10 分钟后，使用微型板读数器在 460nm 处测定发射光值。使用 Xlfit 软件测定 IC₅₀ 值，使用 Cheng-Prusoff 公式: IC₅₀/(1+[底物浓度]/K_m)计算 K_i 值</p>
细胞实验	<p>Cell lines: Colo205, HCT-116, A2780, PC3, A2780, DU145, MCF7, BT549, MDA-MB231, T47D, NHI-H460, A549 等等。</p> <p>Concentrations: 1.5 nM 到 100 μM.</p> <p>Incubation Time: 96 小时</p> <p>Method: 细胞接种在 96 孔板上，黏着细胞搁置 24 小时，悬浮细胞搁置 2 小时，然后加入 SB939 处理。加入 1% 溶剂进行实验, 实验持续 96 小时。根据说明书，针对黏着细胞使用 CyQUANT 细胞增殖实验试剂，针对悬浮细胞使用 CellTiter96 Aqueous 细胞增殖试剂盒，加入浓度为 100 μM 到 1.5 nM 的 SB939，全部体积为 100 μL。使用 Xlfit 软件测定 IC₅₀ 值。</p>

动物实验	Animal Models: 携带 HCT-116 移植瘤模型的雌性 BALB/c 裸鼠 Formulation: SB939 预存在溶于水的 0.5%甲基纤维素(w/v) 和 0.1% Tween-80 中 ,用于口服饲喂处理。用于药物动力学分析, SB939 溶于盐水中, 用于静脉注射处理。 Dosages: 25, 50, 75, 或 100 mg/kg. Administration: 口服饲喂或者静脉注射处理
-------------	--

【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(M ²)	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。