

Belinostat (PXD101)

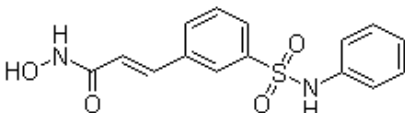
产品编号：MB7001

质量标准：>98%

包装规格：20MG;100MG;500MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C15H14N2O4S	结 构 式	
分子量	318.35		
CAS No.	414864-00-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 64 mg/mL (201.03 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：Belinostat (PXD101)是一种新型 HDAC 抑制剂。**别名：**2-Propenamide, N-hydroxy-3-[3-[(phenylamino)sulfonyl]phenyl]-**物理性状及指标：**

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO : 64 mg/mL (201.03 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	Belinostat (PXD101)是一种新型 HDAC 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 27 nM，对耐 Cisplatin 的肿瘤具有活性。
特性	Belinostat 是 Topotarget 的领先药物，已经进行过多次临床试验。
靶点	HDAC (Cell-free assay)

	27 nM
体外研究	Belinostat 抑制肿瘤细胞生长(包括 A2780, HCT116, HT29, WIL, CALU-3, MCF7, PC3, 及 HS852), IC50 为 0.2 到 0.66 μ M。Belinostat 作用于 A2780/cp70 和 2780AD 细胞时活性很低, 这两个细胞是抗 cisplatin 和 doxorubicin 的 A2780 细胞衍生的。Belinostat 通过 PARP 分裂和组蛋白 H3/H4 的乙酰化而诱导细胞凋亡。Belinostat 抑制膀胱癌细胞生长, 尤其是 5637 细胞, 细胞在 G0-G1 期积累, 在 S 期下降, 在 G2-M 期上升。Belinostat 抑制细胞生长的活性不受多重耐药表现型的影响, 但是 docetaxel 的活性明显受影响。Belinostat 可以增强 docetaxel 或 carboplatin 抑制 OVCAR-3 和 A2780 细胞的活性。Belinostat 作用于卵巢癌细胞系也增强微管乙酰化作用。最新研究显示 Belinostat 在 TGF- β 信号依赖机制中激活蛋白激酶 A 和降低 survivin mRNA。
体内研究	Belinostat 按 10mg/kg 剂量处理 A2780 和 A2780/cp70 移植瘤, 明显延迟肿瘤生长, 但是对动物体重没有影响。在鼠膀胱细胞中, Belinostat 也诱导 p21WAF1, HDAC 核心和细胞通讯基因。Belinostat 按 100mg/kg 剂量单独处理 A2780 移植瘤, 产生抗癌功效, 肿瘤抑制率 (TGI) 达 47%, 这种抑制存在剂量依赖性。100 mg/kg Belinostat 和 40 mg/kg Carboplatin 联用可以延迟肿瘤生长, 从 18.6 天到 22.5 天。Bortezomib 和 Belinostat 联用, 明显抑制肿瘤, 此外, 作用于携带抗 Bortezomib UMSSC-11A 移植瘤的鼠显示肠胃毒性。

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)

MB6006	Pracinostat (SB939)
MB3565	Quisinostat (JNJ-26481585) 2HCl
MB3746	RGFP966

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。Belinostat (PXD101) 是一种新型 HDAC 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	3.1412 mL	15.7060 mL	31.4120 mL
5 mM	0.6282 mL	3.1412 mL	6.2824 mL
10 mM	0.3141 mL	1.5706 mL	3.1412 mL
50 mM	0.0628 mL	0.3141 mL	0.6282 mL

经典实验操作 (仅供参考)

<p>激酶实验</p>	<p>组蛋白脱乙酰基酶活性实验: 汇合培养, 用冷 PBS 中冲洗 2 遍, 按 200×g 转速离心 5 分钟。细胞悬浮在 2 体积的溶解 buffer 中, 60 mm Tris buffer (pH 为 7.4) 包含 30%甘油和 450 mm NaCl, 用干冰冻结, 然后 30oC 水浴溶解, 循环 3 次。细胞碎片按 1.2×104g 转速离心 5 分钟, 然后上清液储存于 -80oC 中。使用 [3H]乙酰 CoA, 通过 p300 的重组蛋白包括次黄嘌呤-氨基嘌呤-胸腺嘧啶乙酰化组蛋白 H4 肽段 (序列为 SGRGKGGKGLGKGGAKRHRK)。100 μg H4 肽段与次黄嘌呤-氨基嘌呤-胸腺嘧啶 buffer (buffer 包含 50 mM Tris HCl pH 为 8.0, 5% 甘油, 50 mM KCl, 和 0.1 mM EDTA) , 1 mM DTT, 1 mM 4-(2-氨基基) , 苯磺酰基氟化物, 1×蛋白酶抑制剂, 50 μL 纯化的 p300, 及 1.85 m [3H]乙酰 CoA (4.50Ci/mmol)混合, 最终体积为 300 μL, 在 30oC 温育 45 分钟。p300 蛋白和 20 μL 50% Ni-琼脂糖在 4oC 下温育 1 小时, 然后离心分离。上清液上样到 2 mL Sephadex G15 柱中。加入 1 毫升蒸馏水, 收集三滴样片, 重复加入蒸馏水直到体积为 4-5 mL, 收集 40 滴样片。用 2 mL 闪烁液稀释 3 微升样片, 在闪烁计数板上计数, 用于鉴定包含标记肽段的样片。合并样片, 测定 1 μL 组合样本, 用于测定每个肽段的放射性。在 150 μL buffer, 2 μL 细胞抽提物, 和 2 μL Belinostat 的混合液中进行反应。加入 2 μL [3H] 标记的底物开始反应。样本在 37oC 下温育 45 分钟, 加入 HCl 和乙酸(终浓度分别为 0.72 和 0.12 M)终止反应。释放的[3H]乙酸盐加到 750 μL of 乙酸乙酯中, 按 1.2×104g 转速离心 5 分钟。上层 (600 μL) 转移到 3 mL 闪烁液, 然后计数。</p>
<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: A2780, A2780/cp70, 2780AD, HCT116, HT29, WIL, CALU-3, MCF7, PC3, 和 HS852 细胞 Concentrations: 0.016 到 10 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 肿瘤细胞系(A2780, A2780/cp70, 2780AD, HCT116, HT29, WIL, CALU-3, MCF7, PC3, 和 HS852) 按 8×104 个细胞/25 cm2 瓶接种在 5 mL 培养基中, 温育 48 小时。用 Belinostat (0.016 到 10 μm)处理细胞 24 小时。1 mL 胰蛋白酶/EDTA 加到培养瓶中。细胞分离后, 加入 1 mL 培养基, 细胞再次悬浮。稀释细胞, 按 0.5-2×103 个细胞/皿移到 6cm Petri 皿中。37oC 下温育 10 到 15 天。用 PBS 冲洗细胞, 溶于甲醇, 用结晶紫染色, 计数大于 50 个细胞的群落。通过 IC50 值计算敏感度。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 右侧腹皮下注射 A2780, A2780/cp70 和 HCT116 细胞的 CD1 nu/nu 鼠 Formulation: Belinostat 溶解在 DMSO 中, 然后用水稀释, 最终浓度 10% Dosages: ≤40 mg/kg Administration: 腹腔注射</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。