

Zotarolimus(ABT-578); 佐他莫司

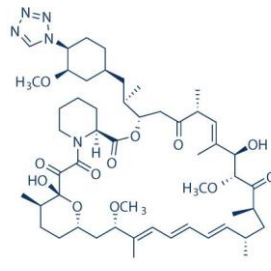
产品编号: MB7469

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5MG; 25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C52H79N5O12	结构式	
分子量	966.21		
CAS No.	221877-54-9		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 100 mg/mL (103.49 mM) Water: Insoluble Ethanol: 100 mg/mL (103.49 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: Zotarolimus (ABT-578)是 rapamycin 的类似物,可以抑制 **FKBP-12** 结合的 **IC50** 为 2.8nM。

别名: 42-deoxy-42-(1H-tetrazol-1-yl)-(42S)-Rapamycin

物理性状及指标:

外观:淡黄色粉末

溶解性:DMSO 100 mg/mL (103.49 mM); Ethanol 100 mg/mL (103.49 mM); Water

Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Zotarolimus (ABT-578)是 rapamycin 的类似物,可以抑制 FKBP-12 结合的 IC50 为 2.8nM。	
特性	Zotarolimus 在体内半衰期短, 并且在大鼠体内表现出比雷帕霉素弱的全身性免疫抑制作用。	
靶点	FKBP-12	2.8 nM

体外研究	Zotarolimus (ABT-578)是雷帕霉素的半合成类似物，由四唑环取代雷帕霉素 42 位上的天然羟基组制成。Zotarolimus 能够高效抑制平滑肌细胞和内皮细胞的增殖，IC50 值分别为 2.9 nM 和 2.6 nM。Zotarolimus 具有与雷帕霉素相似的结合免疫蛋白 FKBP12 的亲合力，也具有相当的抑制人和大鼠 T 细胞体外增殖的效力。Zotarolimus 抑制 Con A 诱导的人 T 细胞和大鼠 T 细胞的增殖，IC50 分别为 7.0 nM 和 1337 nM。
体内研究	在 28 天充分表征的冠状动脉再狭窄的猪模型中，Zotarolimus 洗脱支架有效减少内膜增生。与金属裸支架相比，Zotarolimus 似乎能够有效防止新生内膜增厚，使后期损失从 1.03mm 降低到 0.62mm，并伴随 47% 的 TVF 减少(15.4%Driver 支架到 8.1%Endeavor 支架)。Zotarolimus 能够有效抑制佐剂 DTH, EAE, 和心脏移植排斥反应，ED50 值分别为 1.72, 1.17, 和 3.71 毫克/千克/天。

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)

MB1197	Rapamycin(Sirolimus)
MB1197-S	Rapamycin(Sirolimus) (标准品)

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。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置:

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.0350 mL	5.1749 mL	10.3497 mL
5 mM	0.2070 mL	1.0350 mL	2.0699 mL
10 mM	0.1035 mL	0.5175 mL	1.0350 mL
50 mM	0.0207 mL	0.1035 mL	0.2070 mL

经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)

激酶实验:	对 FKBP12 的亲合力: 96 孔微量滴定板首先用 FKBP-12 CMP-KDO 合成酶融合蛋白以 10 微克/毫升, 100 微升/孔涂层 2-3 小时, 随后加入 50 微升/孔缓冲液 A(2% BSA 和 0.2% Tween-20 D-PBS 溶液) 进行 30-60 分钟。然后将微量滴定板用缓冲液 B(0.2% Tween 的 D-PBS 溶液, pH 调节为 7.4)清洗 3 次。50 微升缓冲液 A(最大), 20 μM FK506 缓冲液 A (背景), 或者各种浓度的 zotarolimus (10 pM-1 μM)在缓冲液 A 中加入到各孔中, 随后加入 50 微升含 A-79397 (一个 FK506 类似物)碱性磷酸酶偶联物缓冲液 A。微量滴定板在室温下培育 2-2.5 小时, 随后用缓冲液 B 清洗 3 次。将大约 100 微升 pNPP (p-硝基苯基-磷酸盐)的 0.1 M 氨基甲基丙醇加入到每孔中, 平板在室温下大约培养 90-120 分钟。405 nm 下的吸光度通过 ELISA 板读取。
细胞实验:	Cell lines: 人冠状动脉细胞 Concentrations: ~1 μM Incubation Time: 5 天 Method: 细胞增殖通过测量体外氘化胸腺嘧啶的整合测定。人冠状动脉细胞(hCa)接种在组织培养瓶中扩增, 并在完全培养基(5000 hCaSMC; 10 000 hCaEC)中以所需浓度应用于 96 孔板。2 天后, 用不完全培养基取代完全培养基使细胞同步, 并诱导 G0 状态。2 天后, 移除不完全培养基, 用完全培养基 (血清/生长因子) 取代以诱导 G0 到 G1 转变。完全培养

	基中也包含所需浓度的药物，以确定其对细胞增殖的影响。在第 7 天，将 3H-胸苷加入到细胞中，并监控 DNA 的合成，放射性整合过夜后收集细胞。培育 72 小时后，每孔加入 25 微升(1 μ Ci/孔) 3H-胸苷。细胞在 37°C 下培育 16-18 小时，以允许 3H-胸苷整合到新合成的 DNA 中，将细胞采集到含有粘合玻璃纤维过滤器的 96 孔板中。将滤板在空气中干燥过夜，MicroScint-20 (25 微升)加入到每个过滤器孔中并计数。药物活性通过 3H-胸苷整合到新合成的 DNA 中相对于细胞在完全培养基中的生长确定。
动物实验:	Animal Models: 雄性 Sprague-Dawley 大鼠 Formulation: 乙醇:丙二醇:聚氧乙烯蓖麻油: D5W 载体 (20: 30: 2: 48, 体积) Dosages: 2.5 毫克/千克 Administration: 静脉注射或口服

【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(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。