

Elacridar (GF120918); 依克立达; GW0918

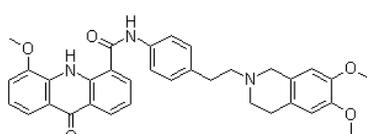
产品编号: MB7522

质量标准: >98%, P 糖蛋白抑制剂

包装规格: 20MG;100MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C34H33N3O5	结 构 式	
分子量	563.64		
CAS No.	143664-11-3		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25° C)	DMSO 8 mg/mL warmed (14.19 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: Elacridar 是一种有效的 P-糖蛋白 (P-glycoprotein) 和 BCRP 的抑制剂。

别名: 依克立达 ; GF120918; GW0918; GG918; GW120918; 4-Acridinecarboxamide, N-[4-[2-(3,4-dihydro-6,7-dimethoxy-2(1H)-isoquinolinyl)ethyl]phenyl]-9,10-dihydro-5-methoxy-9-oxo

物理性状及指标:

外观:淡黄色至棕色固体

溶解性:DMSO 8 mg/mL warmed (14.19 mM); Water Insoluble; Ethanol 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	Elacridar (GF120918) 是一种有效的 P-gp (MDR-1) 和 BCRP 抑制剂。
靶点	P-gp BCRP
体外研究	Elacridar 抑制 [3H]azidopine 对 P 糖蛋白的标记, IC50 值为 0.16 μM。在 Caki-1 和 ACHN 细胞中, elacridar (2.5 μM) 显著抑制细胞生长。Elacridar 能够抑制 P 糖蛋白的活性。Elacridar 和 sunitinib 的联合使用显著降低 ABC 亚家族 B 分子 2 (ABCG2) 在 786-O 细胞中的表达
体内研究	在野生型小鼠中, elacridar (100 毫克/千克, 腹腔注射) 和 crizotinib 口服联合给药, 增加血浆和脑组织中 crizotinib 的浓度, 和 crizotinib 的大脑-血浆比值, 与 Abcb1a/1b; Abcg2-/- 小鼠体内水平相当。在弗兰德白血病病毒染色的 B 模型小鼠中, elacridar 静脉注射 (2.5 毫克/千克), 腹腔注射 (100 毫克/千克) 和口服 (100 毫克/千克) 后, 大脑-血浆中的分配系数 (Kp, 大脑) 分别为 0.82, 0.43 和 4.31。在 Mrp4 (-/-) 模型小鼠中, elacridar 充分抑制 P 糖蛋白介导的 topotecan 转运, 但是对 Bcrp1 介导的转运抑制效果有限

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)

MB5462	Tariquidar, XR-9576
MB4259	Zosuquidar (LY335979) 3HCl

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 Elacridar 是一种有效的 P-糖蛋白 (P-glycoprotein) 和 BCRP 的抑制剂, 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	1.7742 mL	8.8709 mL	17.7418 mL
5 mM	0.3548 mL	1.7742 mL	3.5484 mL
10 mM	0.1774 mL	0.8871 mL	1.7742 mL
50 mM	0.0355 mL	0.1774 mL	0.3548 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>P-gp 的光亲和性放射性标记: 10 微升未标记的细胞膜悬液 (蛋白量 0.4 毫克/毫升) 等分加入到 96 孔板中。然后每孔加 5 微升 GF120918。板在 25°C 下避光培养 25 分钟。每孔加 5 微升氚标记的 azidopine (1.8 TBq/mmol) (0.6 μM in HCl 0.2 mM)。25°C 下避光培养 25 分钟后, 用薄层色谱法设计的 UV 紫外灯直接与板接触, 0°C 下, 254 nm 光照样品 2 分钟。用十二烷基硫酸钠聚丙烯酰胺凝胶电泳的上样缓冲液溶解样品, 但不加热。7.5% 聚丙烯酰胺凝胶电泳分离后, 凝胶经荧光放大处理, 感光胶片曝光 3 天。用 Camag 薄层色谱扫描仪 II 密度计分析荧光显影。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: ACHN, Caki-1, 786-0, 和 MCF-7 细胞 Concentrations: ~ 5 mM Incubation Time: 48 小时 Method: 以 3000 个细胞/孔的密度接种至 96 孔板中。培养 24 小时后, 将适宜浓度梯度的 elacridar 加至孔中。培养 48 小时后, 使用增殖试剂, MTT 检测细胞活性。对照组细胞用载体 (1% DMSO) 处理。最终培育后, 抽出培养基, 沉淀的甲瓚晶体溶解在 DMSO (100 微升/孔) 中。每孔的吸光度在 540 nm 下测量, 以 650 nm 为参比波长, 在 multiskan JX 酶标仪上读取数据。细胞活性以对照组值的百分比计算。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 雄性野生型, Abcb1a/1b-/-34, Abcg2 -/-32 和 Abcb1a/1b; Abcg2 Formulation: DMSO 混合物, 聚山梨醇酯 80, 乙醇, 和水 (1.8:1.17:6.03:1, v/v/v/v) Dosages: 100 毫克/千克 Administration: 口服</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。