

FX-11 (LDHA Inhibitor FX11)

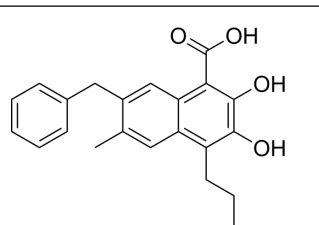
产品编号: MC8011

质量标准: >99%, BR

包装规格: 5mg / 10mg

产品形式: 固体

基本信息:

| | | | |
|---------|--|-----|---|
| 分子式 | C ₂₂ H ₂₂ O ₄ | 结构式 |  |
| 分子量 | 350.41 | | |
| CAS No. | 213971-34-7 | | |
| 储存条件 | -20℃, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 运输条件 | 湿冰运输 (按季节) | | |

简介: FX-11 是一种有效的、选择性的、可逆的和竞争性的乳酸脱氢酶 A (LDHA) 抑制剂, K_i 为 8 μ M。FX-11 可降低 ATP 水平, 诱导氧化应激、ROS 生成和细胞死亡。FX-11 在淋巴瘤和胰腺癌异种移植中显示出抗肿瘤活性。

物理性状及指标:

外观:白色至类白色固体

溶解性:DMSO: 50mg/mL; 水中不溶

有机溶剂残留:符合 ICH 及中国药典规定

纯度:>98%

用途及描述: 科研试剂, 仅限应用于分子生物学、药理学等科研方面, 严禁用于人体。FX-11 是一种细胞可渗透的棉酚类似物, 可作为 LDHA 的选择性, 可逆和 NADH 竞争性抑制剂。即使在较高浓度下也不影响 LDHB 和甘油醛-3-磷酸脱氢酶的活性。显示可增加 P493 人淋巴瘤 B 细胞中的耗氧量, ROS 生成和细胞死亡。还显示可降低线粒体跨膜电位和 ATP 水平并增加 AMP 激酶活性。当与 FK866 组合时, 在 P493 细胞中表现出协同毒性, 可阻断人淋巴瘤和胰腺癌异种移植的进展。

生物活性:

| | |
|------|---|
| 靶点 | IC ₅₀ : 23.3 μ M (LDHA in HeLa cell) |
| 体外研究 | FX-11(9 μ M, 24-48h) 显示 AMP 激酶的激活及其底物乙酰辅酶 A 羧化酶的磷酸化 ^[1] 。 FX-11 在 P493 细胞中抑制糖酵解并改变细胞能量代谢 ^[1] 。 FX-11(0-100 μ M, 72h) 在 BxPc-3 和 MIA PaCa-2 细胞中抑制细胞增殖 ^[2] 。 |
| 体内研究 | FX-11(42 μ g/小鼠; IP, 每日 1 次, 持续 10-14 天)抑制 P493 肿瘤生长 ^[1] 。 FX-11(0-2 mg/kg, IP, 每天, 持续 3 周) 显著延缓肿瘤生长 ^[2] 。 |

溶液配制:

| 制备储备液 | 溶剂体积 / 质量 | | 1mg | 5mg | 10mg |
|-------|-----------|--|-----------|------------|------------|
| | 浓度 | | | | |
| | 1 mM | | 2.8538 mL | 14.2690 mL | 28.5380 mL |
| | 5 mM | | 0.5708 mL | 2.8538 mL | 5.7076 mL |
| | 10 mM | | 0.2854 mL | 1.4269 mL | 2.8538 mL |



使用方法: (仅供参考)

| | |
|-------------|---|
| 细胞试验 | <p>Cell lines: BxPc-3 或 MIA PaCa-2 细胞</p> <p>Concentrations: 0~100μM</p> <p>Incubation Time: 72 小时</p> <p>Method: 将 BxPc-3 或 MIA PaCa-2 细胞以 3000~5000 的密度置于 96 孔板上, 加入不同浓度的 TEPP-46, FX-11 或两种药物组合, 孵育 72 小时。用 MTS 使用方法测定细胞增殖。</p> |
| 动物实验 | <p>Animal Models: 雄性 SCID 小鼠和 RH-Foxn1nu 小鼠(人 P493 b 细胞异种移植)</p> <p>Formulation: 溶于 DMSO, 用生理盐水稀释</p> <p>Dosages: 2.1mg/kg, 每日 5 次, 持续 10~14 天</p> <p>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(如 0.22 μ m 滤膜过滤), 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 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。
- 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。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 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。

参考文献

- [1]. Le A, et, al. Inhibition of lactate dehydrogenase A induces oxidative stress and inhibits tumor progression. Proc Natl Acad Sci U S A. 2010 Feb 2;107(5):2037-42.
- [2]. Mohammad GH, et al. Targeting Pyruvate Kinase M2 and Lactate Dehydrogenase A Is an Effective Combination Strategy for the Treatment of Pancreatic Cancer. Cancers (Basel). 2019 Sep 16;11(9):1372.

S241001

