

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	V80001
产品名称:	伏立诺他

产品简介:

一种强效、选择性和细胞渗透的 HDAC 抑制剂。							
靶点:	HDAC1	HDAC3	HDAC2	HDAC7	HDAC11	Autophagy	Mitophagy
	10nM(ID50)	20nM(ID50)					
体外研究:							
Vorinostat 以低剂量 (3 μ M) 在处理 24 小时后即可有效抑制 MES-SA 细胞生长。该处理优先影响 I 类 HDAC (HDAC2 和 3) 以及 II 类 HDAC (HDAC7)。Vorinostat 显著增加 MES-SA 细胞中的 p21WAF1 表达和细胞凋亡。							
Vorinostat 抑制 SK-N-SH 和 SK-N-Be(2)C, IC25 值分别为 1 μ M 和 0.5 μ M。							
Vorinostat 是 HPV-18 DNA 扩增的有效抑制剂,可降低癌蛋白 E6 和 E7 活性并引发 HPV 感染分化细胞的细胞凋亡。							
体内研究:							
Vorinostat (50 mg/kg//天) 可使注射了 5×10^6 MES-SA 细胞的裸鼠的肿瘤生长减少 50% 以上。							

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
溶于 DMSO (≥ 15 mg/mL) 和甲醇				
浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
	1 mM			
	5 mM			
10 mM		0.3783 mL	1.8916 mL	3.7833 mL
储备液的保存方式: -80° C, 1 year; -20° C, 6 months.				
二: 体内实验				
1、请依序添加每种溶剂: 5% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 50% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.46 mM); 澄清溶液				
2、请依序添加每种溶剂: 5% DMSO $\rightarrow$ 95% (20% SBE- β -CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (9.46 mM); 澄清溶液				
3、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.87 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。				



4、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in Saline)

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.87 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。

2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。

5、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (7.87 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

6、请依序添加每种溶剂： 20% HP-β-CD in Saline

Solubility: 3.33 mg/mL (12.60 mM); 澄清溶液; 超声助溶

注: 工作液建议您现用现配, 在短期内尽快用完。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

三、激酶实验

组蛋白去乙酰化酶活性测定:

为了进行 HDAC 实验 24×10^4 dpm 乙醇溶液 (1 mCi/ml) 中提供的 sup>3H-醋酸钠盐标记的组蛋白 H4 等份样, 加到每个试管中, 试管中含悬浮在 25 μ L 实验 buffer (100 mM Tris-HCl pH 8, 2mM EDTA) 中的 200 μ g 全部 HeLa 细胞裂解液进行免疫沉淀获得的 HDAC。加入不同浓度 Vorinostat, 在 30°C 下温育 90 分钟。加入 20 μ L 终止缓冲液 (0.5 N HCl, 0.08 M AcOH) 终止反应。加入 0.8 mL TBME 提取释放放入氚醋酸盐。在 $8,000 \times g$ 转速下离心 5 分钟, 600 μ L 有机相 (上相) 转移到包含 3 mL 闪烁液的闪烁瓶中。

四、细胞实验

细胞系: NB4, NCI-H460 和 HCT-116 肿瘤细胞系

浓度: 0 μ M - 0.1 μ M

处理时间: 48 小时

方法: NB4, NCI-H460 和 HCT-116 肿瘤细胞系生长在 200 μ L 96 孔板中, 约 10% 汇合, 生长 24 小时后, 覆盖孔中。使用多种浓度 Vorinostat 或溶剂处理肿瘤细胞 24 小时。处理后, 冲洗实验板, 移除 Vorinostat, 温育 48 小时。使用 sulphorodamine B 实验测定 Vorinostat 处理后存活细胞的分。

五、动物实验

动物模型: 植入 CWR22 肿瘤细胞的雄性 BALB/c 裸鼠

剂量: 25, 50, and 100 mg/kg/day

给药处理: 腹腔注射

注意事项:

1、为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存: -20°C

