

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	T14436
产品名称:	Tucidinostat (Chidamide)

产品简介:

一种有效的, 可口服的 HDAC 第 I 类 HDAC1/2/3 和第 IIb 类 HDAC10 的抑制剂, IC₅₀ 值分别为 95, 160, 67 和 78 nM, 对 HDAC8 和 HDAC11 的作用较弱 (IC₅₀, 733 nM, 432 nM), 对 HDAC4/5/6/7/9 无作用。

靶点:	HDAC3	HDAC10	HDAC1	HDAC2	HDAC11	HDAC8
	67 nM (IC ₅₀)	78 nM (IC ₅₀)	95 nM (IC ₅₀)	160 nM (IC ₅₀)	432 nM (IC ₅₀)	432 nM (IC ₅₀)

体外研究:

Tucidinostat (Chidamide/CS055/HBI -8000) 是一种有效的口服生物可利用的 HDAC 酶 I 类 (HDAC 1,2,3) 和 IIb 类 (HDAC10) 抑制剂, IC₅₀ 为 95, 160, 67 和 78 nM, 对 HDAC8 和 HDAC11 的活性较低 (IC₅₀, 分别为 733 nM, 432 nM), 对 HDAC4/5/6/7/9 没有影响 (IC₅₀, >30 μM)。Tucidinostat 具有强大的抗肿瘤活性, 可抑制多种人源性肿瘤细胞系, 例如 HL-60、U2OS、LNCaP、GI50s 分别为 0.4 ± 0.1、2.0 ± 0.6 和 4.0 ± 1.2 μM。此外, Tucidinostat 对人胎肾 (CCC-HEK) 和肝 (CCCHL) 的正常细胞显示出较低的毒性。

体内研究:

Tucidinostat (12.5-50 mg/kg, po) 在荷有 HCT-8 结直肠癌、A549 肺癌、BEL-7402 肝癌和 MCF-7 乳腺癌的小鼠中剂量依赖性地减小肿瘤大小和肿瘤重量, 并且没有明显的身体损失。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验

DMSO: 50 mg/mL (128.07 mM; 超声助溶)

Ethanol: 1 mg/mL (2.56 mM; 超声助溶 (<60° C))

浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.5614 mL	12.8070 mL	25.6141 mL
5 mM	0.5123 mL	2.5614 mL	5.1228 mL
10 mM	0.2561 mL	1.2807 mL	2.5614 mL

储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year.

二: 体内实验

1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.40 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。



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

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.40 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 25.0 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。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.40 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中，混合均匀。

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<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、细胞实验

细胞系：PBMC 效应细胞

浓度：0-400 nM

处理时间：24-72 h

方法：将分离的 PBMC 效应细胞接种于 6 孔板（细胞密度为 6×10^6 cells/孔），用不同浓度的 chidamide (0-400 nM) 处理细胞一定时间（24-72 h）。

四、动物实验

动物模型：Athymic nude mice (BALB/c-nu)

剂量：12.5-50 mg/kg

给药处理：oral

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℃

