

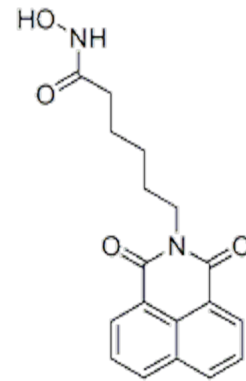
Scriptaid (HDAC抑制剂)

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|------------|
| SC9132-10mM | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 10mM×0.2ml |
| SC9132-5mg | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 5mg |
| SC9132-25mg | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 25mg |

产品简介:

➤ 化学信息:

| | |
|--------|---|
| 化学名 | 6-(1,3-dioxobenzo[de]isoquinolin-2-yl)-N-hydroxyhexanamide |
| 简称 | Scriptaid |
| 别名 | GCK1026, CGK-1026, CGK 1026 |
| 中文名 | N/A |
| 化学式 | C ₁₈ H ₁₈ N ₂ O ₄ |
| 分子量 | 326.35 |
| CAS号 | 287383-59-9 |
| 纯度 | 98% |
| 溶剂/溶解度 | Water <1mg/ml; DMSO 65mg/ml; Ethanol <1mg/ml |
| 溶液配制 | 5mg加入1.53ml DMSO, 或每3.26mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC9132-10mM用DMSO配制。 |



➤ 生物信息:

| | | | | | |
|------|--|---|---|---|---|
| 产品描述 | Scriptaid是一种HDAC抑制剂, 作用于乙酰化H4比作用于H3效果高很多。 | | | | |
| 信号通路 | DNA Damage; Epigenetics; NF-κB | | | | |
| 靶点 | HDAC | — | — | — | — |
| IC50 | — | — | — | — | — |
| 体外研究 | <p>Scriptaid(6μM)作用于PANC-1细胞, 使组蛋白乙酰化增加100倍以上。Scriptaid(8μM)对PANC-1细胞是非致命的, 对MDA-MB-468具有有限效果(80%存活)。Scriptaid增加pCMVb、p6SBE-luc和p6MBE-luc非依赖性的转录。Scriptaid能够诱导病毒(SV40和CMV)或人类(泛素c, UB6) 启动子驱动的p6MBE-luc、pCMVb和pUB6/V5-LacZ高表达, 这不依赖于增强子(SBE与MBE)的特异性, 启动子的类型(病毒与细胞), 报告基因(荧光素酶与β-半乳糖苷酶)的产物, 及报告基因构造的整合状态。Scriptaid诱导体细胞核转移(SCNT)卵母细胞发育到囊胚期的高发生率, 并在所有浓度(分别为50、100、250、500和2000nM)。都使其足月发展(分别为3.4、4.2、7.6、6.8和4.1%)。Scriptaid促进了克隆的B6D2F1胚胎足月发展, 这种作用存在剂量依赖下, 在250nM处达到最大效果。Scriptaid克隆所有重要的近交系小鼠品系, 如C57BL/6、C3H/He、DBA/2和129/Sv。Scriptaid处理克隆的胚胎, 增强新合成的mRNA水平。250nM Scriptaid处理ICSI受精的胚胎长达48小时, 不抑制发育。Scriptaid抑制T. gondii tachyzoite增殖, IC50为39nM。Scriptaid(0.225μM)完全保护HS68单层细胞免受T. gondii tachyzoite侵袭。Scriptaid抑制ER阴性细胞系MDA-MB-231、MDA-MB-435和Hs578t生长, 处理48小时后, IC50为0.5-1.0μg/ml。1μg/ml Scriptaid处理48小时, 诱导乙酰化的H3和H4组蛋白尾部蛋白的积累, 促进ER mRNA转录, 最大程度提高20000倍。Scriptaid抑制Ishikawa子宫内膜癌细胞系和SK-OV-3卵巢癌细胞系的增殖和生存力, IC50分别为9μM和55μM, 而对正常子宫内膜上皮细胞则几乎没有灵敏度。在Scriptaid存在时, 子宫内膜癌细胞和卵巢癌细胞培养2天, 细胞在G0/G1期(5μM Scriptaid处理)和G2/M期(10μM Scriptaid处理)积累, 而S期比例则相应减少。10μM Scriptaid诱导56.1% Ishikawa细胞凋亡, 及线粒体膜电位损失, 并降低cyclin A和bcl-2水平, 分别为50%和20%。</p> | | | | |
| 体内研究 | <p>Scriptaid按1.5到5.5mg/kg剂量处理, 引发病灶尺寸减小(最大跌幅45%), 这种作用存在剂量依赖性, 且随后降低运动和认知缺陷。即使延迟至伤后12小时再处理, 也能达到类似的保护效果。运动和认知功能的保护是长期持久的, 在伤后35天也能检测到类似的效果。Scriptaid处理海马和pericontusional皮层的CA3区, 诱导存活神经元增加(42%), 以及它们的存活数/存活时间增加。Scriptaid处理皮层和CA3区海马神经元, 抑制磷酸化-AKT(p-AKT)和磷酸化的磷酸酶, 及TBI的10号染色体上删除的张力蛋白同源物(p-PTEN)降低。Scriptaid按3.5mg/kg剂量处理人类乳腺癌移植瘤MDA-MB-231模型, 显著抑制肿瘤生</p> | | | | |

| | |
|------|---------------|
| | 长, 减少75%肿瘤体积。 |
| 临床实验 | N/A |
| 特征 | N/A |

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

| 酶活性检测实验 | |
|---------|---|
| 方法 | 使用2 μ g/ml Scriptaid在培养基中处理PANC-1细胞18个小时。使用胰蛋白酶-EDTA收集处理的和未处理的细胞,使用PBS洗涤,然后再悬浮于蛋白样品缓冲液中。使用BCA蛋白检测试剂测定蛋白浓度。每组样品中的50 μ g蛋白上样到12%变性聚丙烯酰胺凝胶上。随后使用MilliblotGraphite Electroblotter 1将蛋白转移到尼龙膜上。尼龙膜与兔抗人类乙酰基-赖氨酸抗体温育, 然后与耦联到辣根过氧化物酶的羊抗兔抗体温育, 再使用, 用SuperSignal处理, 并通过显影检测。 |

| 细胞实验 | |
|------|---|
| 细胞系 | 人类乳腺癌细胞MDA-MB-231 |
| 浓度 | ~10 μ g/ml |
| 处理时间 | 3天 |
| 方法 | 细胞按每孔5000个接种在12孔板上, 使用Scriptaid处理3天。使用Coulter计数器每天进行细胞计数。 |

| 动物实验 | |
|------|--------------------------|
| 动物模型 | 人类乳腺癌移植瘤MDA-MB-231 |
| 配制 | DMSO |
| 剂量 | 3.5mg/kg |
| 给药方式 | 腹腔处理, 连续5天, 每周休息2天, 持续4周 |

➤ 参考文献:

- 1.Su GH, et al. Cancer Res, 2000, 60(12), 3137-3142.
- 2.Van Thuan N, et al. Reproduction, 2009, 138(2), 309-317.
- 3.Strobl JS, et al. J Parasitol, 2007, 93(3), 694-700.
- 4.Keen JC, et al. Breast Cancer Res Treat, 2003, 81(3), 177-186.
- 5.Takai N, et al. Int J Mol Med, 2006, 17(2), 323-329.
- 6.Wang G, et al. Neurotherapeutics, 2013, 10(1), 124-142.

包装清单:

| 产品编号 | 产品名称 | 包装 |
|-------------|---------------------|---------------------|
| SC9132-10mM | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 10mM \times 0.2ml |
| SC9132-5mg | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 5mg |
| SC9132-25mg | Scriptaid (HDAC抑制剂) | 25mg |
| — | 说明书 | 1份 |

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01