

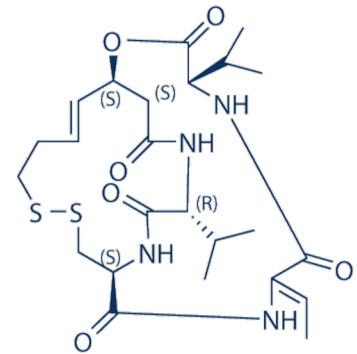
Romidepsin (HDAC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1087-10mM	Romidepsin (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1087-5mg	Romidepsin (HDAC抑制剂)	5mg
SD1087-25mg	Romidepsin (HDAC抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(1S,4S,7Z,10S,16E,21R)-7-ethylidene-4,21-di(propan-2-yl)-2-oxa-12,13-dithia-5,8,20,23-tetrazabicyclo[8.7.6]tricos-16-ene-3,6,9,19,22-pentone
简称	Romidepsin
别名	FK228, FK 228, FK-228, Depsipeptide, FR 901228, FR-901228, FR901228, Istodax
中文名	罗米地辛
化学式	C ₂₄ H ₃₆ N ₄ O ₆ S ₂
分子量	540.7
CAS号	128517-07-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 10mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.92ml DMSO, 或每5.41mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1087-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Romidepsin (FK228, Depsipeptide)是一种有效的HDAC1和HDAC2抑制剂, 无细胞试验中IC50分别为36nM和47nM。				
信号通路	Epigenetics; Cytoskeletal Signaling; DNA Damage; NF-κB				
靶点	HDAC1	HDAC2	—	—	—
IC50	36nM	47nM	—	—	—
体外研究	Romidepsin抑制NSCLC细胞系生长, IC50范围从1.3ng/ml到4.9ng/ml。Romidepsin可以降低Erlotinib对NSCLC细胞系的IC50值, 增加NSCLC细胞系对Erlotinib的敏感性。Romidepsin处理72小时可以抑制6/6人NB肿瘤细胞系的生长, 而NIH3T3细胞系并不受影响。Romidepsin对于单拷贝或N-myc多拷贝的NB细胞系以及含有正常或突变的p53和含有Alk突变体的细胞系都有选择性的细胞毒性, 这种毒性具有剂量依赖的特性。				
体内研究	与PBS处理的对照组相比, 单独使用Erlotinib和Romidepsin分别可以对NCI-H1299细胞系的异种移植生长抑制到72%和43%, 但是并不具有明显的统计学意义。只有当两种药物联用的时候才会对其生长造成明显的抑制作用, 此时生长被抑制到28%。在免疫功能低下的小鼠中, Romidepsin会抑制皮下NB异种移植的生长, 这种抑制作用具有剂量依赖的特性。此外, 在NB病人的肿瘤组织中Romidepsin会诱导某些基因的表达, 如p21和p75以及NTRK(TrkA)。				
临床实验	N/A				
特征	Romidepsin对I型HDAC的抑制作用明显强于对II型HDAC的抑制。				

➤ 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	For the enzyme assay, 10μl of [³ H]acetyl-labeled histones (25000 cpm/10μg) are added to 90μl of the HDAC enzyme fraction extracted from 293T cells overexpressing HDAC1 or HDAC2 in the presence of increasing concentrations of Romidepsin, and the mixture is incubated at 37°C for 15 minutes. The enzyme reaction is linear for at least 1 hour. The reaction is stopped by the addition of 10μl of concentrated HCl. The released [³ H]acetic acid is extracted with 1ml of ethylacetate, and 0.9ml of the solvent layer is taken into 5ml of aqueous counting scintillant II solution for determination of radioactivity. The IC50 values are determined from at least

	three independent dose-response curves.
--	---

细胞实验	
细胞系	NCI-H1975, NCI-H157, NCI-2882, NCI-H460和HCC95细胞系
浓度	1ng/ml
处理时间	72小时
方法	使用MTS法分析药物敏感性。在96孔平板中每孔接种 2×10^3 个细胞(包括NCI-H1975, NCI-H157, NCI-2882, NCI-H460和HCC95)。24小时后, 在存在或者缺少1ng/ml Romidepsin的条件下将细胞与不同浓度(0.01 μ M-250 μ M)的Erlotinib 37°C孵育72小时。MTS溶液加到每个孔中37°C孵育1小时。利用分光光度计测量490nm处的光密度值。每种药物浓度的实验都设置8个复孔并重复两次。基于细胞生存曲线的吸光度值计算药物的半抑制浓度(IC50)。

动物实验	
动物模型	携带NCI-H1299细胞的BALB/c无胸腺裸小鼠
配制	用PBS配制
剂量	1.2mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ 参考文献:

- 1.Furumai R, et al. Cancer Res, 2002, 62(17), 4916-4921.
- 2.Sandor V, et al. Br J Cancer, 2000, 83(6), 817-825.
- 3.Blagosklonny MV, et al. Mol Cancer Ther, 2002, 1(11), 937-941.
- 4.Kwon HJ, et al. Int J Cancer, 2002, 97(3), 290-296.
- 5.Sasakawa Y, et al. Biochem Pharmacol, 2002, 64(7), 1079-1090.
- 6.Aron JL, et al. Blood, 2003, 102(2), 652-628.
- 7.Lundqvist A, et al. Cancer Res, 2006, 66(14), 7317-7325.
- 8.Dai Y, et al. Clin Cancer Res, 2008, 14(2), 549-558.
- 9.Paoluzzi L, et al. Clin Cancer Res, 2010, 16(2), 554-565.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1087-10mM	Romidepsin (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1087-5mg	Romidepsin (HDAC抑制剂)	5mg
SD1087-25mg	Romidepsin (HDAC抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°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°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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