

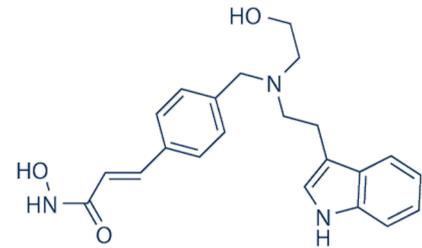
LAQ824 (HDAC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1105-10mM	LAQ824 (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1105-5mg	LAQ824 (HDAC抑制剂)	5mg
SD1105-25mg	LAQ824 (HDAC抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(E)-N-hydroxy-3-[4-[[2-hydroxyethyl-[2-(1H-indol-3-yl)ethyl]amino]methyl]phenyl]prop-2-enamide
简称	LAQ824
别名	Dacinostat, LAQ824, LAQ-824, NVP-LAQ824, NVP-LAQ824
中文名	达诺司他
化学式	C ₂₂ H ₂₅ N ₃ O ₃
分子量	379.459
CAS号	404951-53-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 76mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.32ml DMSO, 或每3.79mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1105-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	LAQ824 (Dacinostat)是新型HDAC抑制剂, IC ₅₀ 为32nM, 且激活p21启动子。				
信号通路	Epigenetics; DNA Damage; NF-κB				
靶点	HDAC	—	—	—	—
IC ₅₀	32nM	—	—	—	—
体外研究	在体外, LAQ824抑制H1299细胞裂解液中的人HDAC活性, IC ₅₀ 为32nM。此外, LAQ824通过激活p21启动子, 也激活编码p21细胞周期抑制剂的基因表达, 最大启动子活性(AC ₅₀)为50%时, 浓度为0.30μM。处理72小时后, LAQ824抑制H1299(一种非小细胞肺癌细胞)和HCT116(一种结肠癌细胞)细胞生长, IC ₅₀ 分别为0.15μM和0.01μM, LAQ824的抗增殖效果选择性作用于肿瘤细胞系。而且, LAQ824作用于A549细胞, 促进p21蛋白增多, 这种作用存在剂量依赖性, 且提高Rb肿瘤抑制基因的次磷酸化状态。最新研究显示LAQ824在IL-10基因启动子水平诱导染色体变化, 导致转录抑制剂HDAC11和PU.1招募增强, 且抑制BALB/c巨噬细胞中IL-10产量。				
体内研究	LAQ824按100mg/kg剂量作用于携带HCT116和人结肠癌移植瘤的裸鼠, 抑制肿瘤生长, 且无细胞毒性, 这种作用存在剂量依赖性。				
临床实验	N/A				
特征	LAQ824是非常有效的组蛋白脱乙酰基酶抑制剂。				

➤ 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	通过离子交换层析, 使用Q琼脂糖快速流动柱, 使HDAC酶部分从H1299细胞溶解物中纯化。通过与cdk2多克隆抗体 或cdk1/cdc2单克隆抗体进行免疫沉淀反应, 从500mg全部细胞溶解物中收集酶复合物。免疫沉淀物再悬浮在激酶buffer(50mM Hepes, pH 8, 10mM MgCl ₂ , 2.5mM EDTA, 1mM二硫苏糖醇, 20mM ATP, 10mM β-甘油磷酸, 0.1mM NaVO ₄ , 1mM NaF, 50mM ATP, 10μCi [γ- ³² P]ATP), 及1μg pRb重组蛋白底物(cdk2)或含20μg底物(cdc2)到的10ml H1组蛋白混合物。电泳分析磷酸化的Rb和H1组蛋白, 然后使用PhosphorImager量化。

细胞实验	
细胞系	H1299, HCT116, DU145, PC3, MDA435

浓度	0到10 μ M
处理时间	48小时
方法	通过3-MTS实验测定细胞增殖。然后进行CellTiter 96 AQueous非放射性细胞增殖实验。取每组实验的平均值。

动物实验	
动物模型	在右腋区皮下注射HCT116细胞的远系繁殖系无胸腺(nu/nu)雌鼠
配制	溶于DMSO
剂量	\leq 100mg/kg
给药方式	静脉注射

➤ **参考文献:**

1. Atadja P, et al. Cancer Res, 2004, 64(2), 689-695.
2. Wang H, et al. J Immuno, 2011, 186(7), 3986-3996.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1105-10mM	LAQ824 (HDAC抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SD1105-5mg	LAQ824 (HDAC抑制剂)	5mg
SD1105-25mg	LAQ824 (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