



碧云天生物技术/Beyotime Biotechnology
 订货热线: 400-168-3301或800-8283301
 订货e-mail: order@beyotime.com
 技术咨询: info@beyotime.com
 网址: http://www.beyotime.com

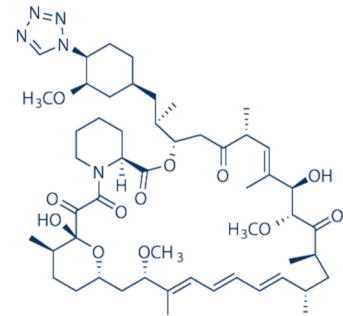
Zotarolimus (mTOR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF2681-10mM	Zotarolimus (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2681-5mg	Zotarolimus (mTOR抑制剂)	5mg
SF2681-25mg	Zotarolimus (mTOR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	42-deoxy-42-(1H-tetrazol-1-yl)-(4S)-Rapamycin
简称	Zotarolimus
别名	ABT-578, ABT 578, ABT578, Zatarolimus
中文名	唑他莫司
化学式	C ₅₂ H ₇₉ N ₅ O ₁₂
分子量	966.21
CAS号	221877-54-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.52ml DMSO, 或每9.66mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF2681-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Zotarolimus (ABT-578)是rapamycin的类似物, 可以抑制FKBP-12结合的IC50为2.8nM。				
信号通路	PI3K/Akt/mTOR				
靶点	FKBP-12	—	—	—	—
IC50	2.8nM	—	—	—	—
体外研究	Zotarolimus (ABT-578)是雷帕霉素的半合成类似物, 由四唑环取代雷帕霉素42位上的天然羟基组制成。Zotarolimus能够高效抑制平滑肌细胞和内皮细胞的增殖, IC50值分别为2.9nM和2.6nM。Zotarolimus具有与雷帕霉素相似的结合免疫蛋白FKBP12的亲合力, 也具有相当的抑制人和大鼠T细胞体外增殖的效力。Zotarolimus抑制Con A诱导的人T细胞和大鼠T细胞的增殖, IC50分别为7.0nM和1337nM。				
体内研究	在28天充分表征的冠状动脉再狭窄的猪模型中, Zotarolimus洗脱支架有效减少内膜增生。与金属裸支架相比, Zotarolimus似乎能够有效防止新生内膜增厚, 使后期损失从1.03mm降低到0.62mm, 并伴随47%的TVF减少(15.4%Driver支架到8.1%Endeavor支架)。Zotarolimus能够有效抑制佐剂DTH, EAE和心脏移植排斥反应, ED50值分别为1.72、1.17和3.71毫克/千克/天。				
临床实验	N/A				
特征	Zotarolimus在体内半衰期短, 并且在鼠体内表现出比雷帕霉素弱的全身性免疫抑制作用。				

➤ 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	96孔微量滴定板首先用FKBP-12 CMP-KDO合成酶融合蛋白以10微克/毫升, 100微升/孔涂层2-3小时, 随后加入50微升/孔缓冲液A(2% BSA和0.2% Tween-20 D-PBS溶液)进行30-60分钟。然后将微量滴定板用缓冲液B(0.2% Tween 的D-PBS溶液, pH调节为7.4)清洗3次。50微升缓冲液A(最大), 20μM FK506缓冲液A(背景), 或者各种浓度的zotarolimus(10pM-1μM)在缓冲液A中加入到各孔中, 随后加入50微升含A-79397(一个FK506类似物)碱性磷酸酶偶联物缓冲液A。微量滴定板在室温下培育2-2.5小时, 随后用缓冲液B清洗3次。将大约100微升pNPP(p-硝基苯基-磷酸盐)的0.1M氨基甲基丙醇加入到每孔中, 平板在室温下大约培养90-120分钟。405nm下的吸光度通过ELISA板读取。

细胞实验	
细胞系	人冠状动脉细胞
浓度	~1μM
处理时间	5天

方法	细胞增殖通过测量体外氘化胸腺嘧啶的整合测定。人冠状动脉细胞(hCa)接种在组织培养瓶中扩增，并在完全培养基(5000 hCaSMC; 10000 hCaEC)中以所需浓度应用于96孔板。2天后，用不完全培养基取代完全培养基使细胞同步，并诱导G0状态。2天后，移除不完全培养基，用完全培养基(血清/生长因子)取代以诱导G0到G1转变。完全培养基中也包含所需浓度的药物，以确定其对细胞增殖的影响。在第7天，将3H-胸苷加入到细胞中，并监控DNA的合成，放射性整合过夜后收集细胞。培育72小时后，每孔加入25微升(1μCi/孔) 3H-胸苷。细胞在37°C下培育16-18小时，以允许3H-胸苷整合到新合成的DNA中，将细胞采集到含有粘合玻璃纤维过滤器的96孔板中。将滤板在空气中干燥过夜，MicroScint-20 (25微升)加入到每个过滤器孔中并计数。药物活性通过3H-胸苷整合到新合成的DNA中相对于细胞在完全培养基中的生长确定。
----	--

动物实验	
动物模型	雄性Sprague-Dawley大鼠
配制	乙醇：丙二醇：聚氧乙烯蓖麻油：D5W载体(20：30：2：48，体积)
剂量	2.5毫克/千克
给药方式	静脉注射或口服

➤ **参考文献：**

- 1.Garcia-Touchard A, et al. Eur Heart J, 2006, 27(8), 988-993.
- 2.Chen YW, et al. J Cardiovasc Pharmacol, 2007, 49(4), 228-235.

包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SF2681-10mM	Zotariolimus (mTOR抑制剂)	10mM×0.2ml
SF2681-5mg	Zotariolimus (mTOR抑制剂)	5mg
SF2681-25mg	Zotariolimus (mTOR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：

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，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