

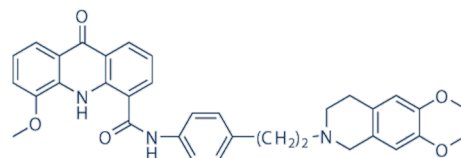
## Elacridar (P-gp抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF9101-10mM	Elacridar (P-gp抑制剂)	10mM×0.2ml
SF9101-5mg	Elacridar (P-gp抑制剂)	5mg
SF9101-25mg	Elacridar (P-gp抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	N-(2,4-ditert-butyl-5-hydroxyphenyl)-4-oxo-1H-quinoline-3-carboxamide
简称	Elacridar
别名	GF-120918, Elacridar (GF120918), GF 120918, ChEMBL396298
中文名	依克立达
化学式	C <sub>34</sub> H <sub>33</sub> N <sub>3</sub> O <sub>5</sub>
分子量	563.64
CAS号	143664-11-3
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 41mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.89ml DMSO, 或每5.64mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF9101-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Elacridar (GF120918)是一种有效的P-gp (MDR-1)和BCRP抑制剂。				
信号通路	Transmembrane Transporters; Neuronal Signaling				
靶点	P-gp	BCRP	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	Elacridar 抑制 [ <sup>3</sup> H]azidopine 对 P 糖蛋白的标记, IC50 值为 0.16 μM。在 Caki-1 和 ACHN 细胞中, elacridar (2.5 μM) 显著抑制细胞生长。Elacridar 能够抑制 P 糖蛋白的活性。Elacridar 和 sunitinib 的联合使用显著降低 ABC 亚家族 B 分子 2 (ABCG2) 在 786-O 细胞中的表达。				
体内研究	在野生型小鼠中, elacridar (100 毫克/千克, 腹腔注射) 和 crizotinib 口服联合给药, 增加血浆和脑组织中 crizotinib 的浓度和 crizotinib 的大脑-血浆比值, 与 Abcb1a/1b、Abcg2 <sup>-/-</sup> 小鼠体内水平相当。在弗兰德白血病病毒染色的 B 模型小鼠中, elacridar 静脉注射 (2.5 毫克/千克), 腹腔注射 (100 毫克/千克) 和口服 (100 毫克/千克) 后, 大脑-血浆中的分配系数 (K <sub>p</sub> , 大脑) 分别为 0.82、0.43 和 4.31。在 Mrp4 <sup>(-/-)</sup> 模型小鼠中, elacridar 充分抑制 P 糖蛋白介导的 topotecan 转运, 但是对 Bcrp1 介导的转运抑制效果有限。				
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	10微升未标记的细胞膜悬液(蛋白量0.4毫克/毫升)等分加入到96孔板中。然后每孔加5微升GF120918。板在25°C下避光培养25分钟。每孔加5微升氚标记的azidopine(1.8TBq/mmol)(0.6μM在0.2mM HCl中)。25°C下避光培养25分钟后, 用薄层色谱法设计的UV紫外灯直接与板接触, 0°C下, 254nm光照样品2分钟。用十二烷基硫酸钠聚丙烯酰胺凝胶电泳的上样缓冲液溶解样品, 但不加热。7.5%聚丙烯酰胺凝胶电泳分离后, 凝胶经荧光放大处理, 感光胶片曝光3天。用Camag薄层色谱扫描仪II密度计分析荧光显影。

细胞实验	
细胞系	ACHN, Caki-1, 786-O和MCF-7细胞
浓度	~5mM
处理时间	48小时

方法	以3000个细胞/孔的密度接种至96孔板中。培养24小时后，将适宜浓度梯度的elacridar加至孔中。培养48小时后，使用增殖试剂，MTT检测细胞活性。对照组细胞用载体(1% DMSO)处理。最终培育后，抽出培养基，沉淀的甲瓚晶体溶解在DMSO(100微升/孔)中。每孔的吸光度在540nm下测量，以650nm为参比波长，在multiskan JX酶标仪上读取数据。细胞活性以对照组值的百分比计算。
----	--

动物实验	
动物模型	雄性野生型, Abcb1a/1b-/-34, Abcg2 -/-32和Abcb1a/1b;Abcg2
配制	DMSO混合物, 聚山梨醇酯80, 乙醇和水(1.8:1.17:6.03:1, v/v/v/v)
剂量	100毫克/千克
给药方式	口服

➤ **参考文献:**

- 1.Tang SC, et al. Int J Cancer. 2014, 134(6), 1484-1494.
- 2.Hyafil F, et al. Cancer Res. 1993, 53(1), 4595-4602.
- 3.Sato H, et al. Eur J Pharmacol. 2015, 746, 258-266.
- 4.Sane R, et al. Drug Metab Dispos. 2012, 40(8), 1612-1619.
- 5.de Vries NA, et al. Clin Cancer Res. 2007, 13(21), 6440-6449.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SF9101-10mM	Elacridar (P-gp抑制剂)	10mM×0.2ml
SF9101-5mg	Elacridar (P-gp抑制剂)	5mg
SF9101-25mg	Elacridar (P-gp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