

HB181207

Mocetinostat

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Mocetinostat	51407ES08	5 mg
Mocetinostat	51407ES10	10 mg

产品描述

Mocetinostat, 又称为 MGCD0103、MG-0103, 是一种强效 HDAC 抑制剂, 对 HDAC1 抑制作用最强 ($IC_{50}=0.15 \mu M$), 其抑制活性是 HDAC2 ($IC_{50}=0.29 \mu M$) 的 2 倍, 是 HDAC3 ($IC_{50}=1.66 \mu M$) 的 10 倍, 而对 HDAC4、5、6、7、8 没有作用。Mocetinostat 诱导组蛋白的高度乙酰化, 引起细胞周期阻断, 抑制多种癌细胞增殖, 并诱导癌细胞凋亡。另外, Mocetinostat 在体内也具有抗肿瘤活性, 抑制小鼠体内人移植瘤的生长。Mocetinostat 与 gemcitabine 联合使用时, 细胞毒性作用增强。

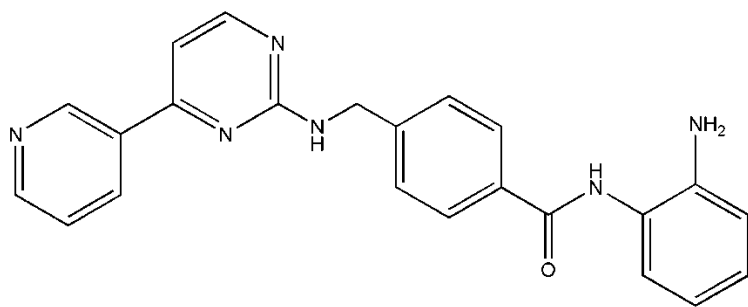
目前, Mocetinostat 已用于临床 Phase 2 研究阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	MGCD0103, MG-0103
化学名 (Chemical Name)	N-(2-aminophenyl)-4-[[[4-(3-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]amino]methyl]-benzamide
靶点 (Target)	HDAC
CAS 号 (CAS NO.)	726169-73-9
分子式 (Molecular Formula)	$C_{23}H_{20}N_6O$
分子量 (Molecular Weight)	396.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (10 mg/ml)

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 $-20 \text{ }^{\circ}\text{C}$, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 $-20 \text{ }^{\circ}\text{C}$ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

为检测 Mocetinostat 对 HDAC 的抑制活性，用 Mocetinostat（0-25 μ M）孵育人 T24 癌细胞，Mocetinostat 以剂量依赖的方式诱导组蛋白 H3 和 H4 乙酰化。^[1]

（二）动物实验（体内研究）

在体内实验中，用 60、120 mg/kg Mocetinostat 处理 A549 移植瘤小鼠，Mocetinostat 显著抑制裸鼠体内移植瘤的生长，作用方式为剂量依赖型。^[1]

参考文献

- [1] Fournel M, et al. MGCD0103, a novel isotype-selective histone deacetylase inhibitor, has broad spectrum antitumor activity in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther.* 7(4): 759-768 (2008).
- [2] Cavasin MA, et al. Selective Class I Histone Deacetylase Inhibition Suppresses Hypoxia-Induced Cardiopulmonary Remodeling Through an Antiproliferative Mechanism. *Circ Res.* 110(5): 739-748 (2012).
- [3] Sung V, et al. Histone deacetylase inhibitor MGCD0103 synergizes with gemcitabine in human pancreatic cells. *Cancer Sci* 102: 1201-1207 (2011).