

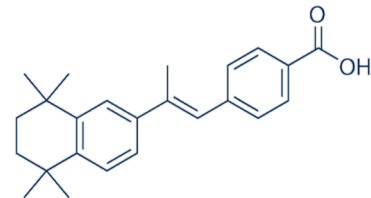
TTNPB (RAP激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SD7230-10mM	TTNPB (RAP激动剂)	10mM×0.2ml
SD7230-5mg	TTNPB (RAP激动剂)	5mg
SD7230-25mg	TTNPB (RAP激动剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[(E)-2-(5,5,8,8-tetramethyl-6,7-dihydronaphthalen-2-yl)prop-1-enyl]benzoic acid
简称	TTNPB
别名	AGN 191183, AGN-191183, Arotinoid Ro-137410, Ro 13-7410, Arotinoid acid, AGN 191183
中文名	芳维甲酸
化学式	C ₂₄ H ₂₈ O ₂
分子量	348.48
CAS号	71441-28-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 15mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.43ml DMSO, 或每3.48mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD7230-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	TTNPB (Arotinoid Acid)是有效的RAR激动剂, 抑制与 ^{[3]H} tRA结合, 作用于人类RARα、β和γ, IC50分别为5.1nM、4.5nM和9.3nM。				
信号通路	Metabolism				
靶点	RARβ	RARα	RARγ	RARγ	—
IC50	4.5nM	5.1nM	9.3nM	9.3nM	—
体外研究	TTNPB以高亲和力结合到核视黄酸受体, 抑制 ^{[3]H} tRA与mRARα、β以及γ的结合, 其IC50分别为3.8nM、4.0nM和4.5nM。在使用条件培养基72小时后, TTNPB增加JEG-3细胞中小鼠RARs的转录活性, 对mRARα、β以及γ的EC50分别为2.0nM、1.1nM和0.8nM。TTNPB通过诱导G1细胞周期阻滞, 抑制正常人体乳腺上皮细胞(HMECs)和雌激素受体-阳性(ER-阳性)乳腺癌细胞的生长。TTNPB引起ES-D3细胞分化的浓度依赖性减少。				
体内研究	TTNPB(0.25毫克/千克)通过诱导细胞凋亡引起MXT-HS和MXT-HI模型的生长抑制。				
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	结合实验如先前所述进行(Allenby et al., 1993, 1994)。简言之, 将标记的和未标记的类视黄酸添加到核叶或胞质部分的乙醇中, 使加入乙醇的总量在所有试管中保持不变, 并且不超过培养基体积的2%。该受体剂与类视黄醇在4°C下培养4-6小时。平衡态实现之后, 交联葡聚糖PD-10脱盐柱被用于从游离的放射性配体中分离结合的放射性配体。对于竞争性结合测定法, 不同浓度的未标记的竞争性配体与适当的核小体或胞质溶胶在固定浓度的 ^{[3]H} tRA (sp. act. 49.3Ci/mmol)或者 ^{[3]H} 9-cis RA(sp. act. 24.0Ci/mmol)存在下被培育。 ^{[3]H} tRA和 ^{[3]H} 9-cis RA在核受体结合实验中的终浓度为5nM。 ^{[3]H} tRA在CRABP结合实验中的终浓度为30nM。计算出的IC50s如上所述(DeLean et al., 1978)。对于饱和和动力学, 在100倍摩尔过量对应的未标记类视黄醇存在(非特异性结合)或不存在(完全结合)下, 增加浓度的放射性配体(^{[3]H} tRA sp. act. 49.3Ci/mmol, ^{[3]H} TTNPB sp. act. 5.5Ci/mMol)被加入到适当受体亚型的核叶中。特异性结合被定义为总结合减去非特异性结合。饱和和动力学的计算如前所述(Scatchard, 1949; Grippo and Gudas, 1987; Levin et

	al., 1992)。
--	-------------

细胞实验	
细胞系	T47D细胞和184细胞
浓度	~1 μ M
处理时间	8-12天
方法	人类乳腺上皮细胞被维持在乳腺上皮基础培养基(MEBM)中, 用乳腺上皮生长培养基(MEGM)试剂盒进行增补。184和184B5细胞被维持在MEBM不含钠-碳酸氢盐(MEBM-SBF)中, 用MEGM试剂盒进行增补, 异丙肾上腺素(10 μ M), 以及转铁蛋白(5微克/毫升)。MCF10A细胞系被维持在DME/F12中, 其包含5%高温灭活的马血清, 青霉素/链霉素(100微克/毫升以及100微克/毫升), 氢化可的松(1.4 μ M), 胰岛素(10微克/毫升), 霍乱毒素(100纳克/毫升), 以及表皮生长因子(20纳克/毫升)。乳腺肿瘤细胞被维持在改进过的MEM锌选择性培养基中, 其包含10%牛胎儿血清, 1%谷氨酸盐, 以及1%青霉素/链霉素。对于生长实验, 细胞在培养基中用不同的类视黄酸处理特定天数, 在T47D细胞中治疗每隔一天发生变化, 在184细胞中治疗每两天发生一次变化。细胞增殖由本方案中CellTiter96含水非放射性细胞增殖试验测定。该比色试验确定样本中活细胞的数量。每个代表样本的点以一式四份进行采样。

动物实验	
动物模型	对激素敏感(HS)和不敏感(HI)品系的患有乳腺癌的MXT小鼠模型
配制	生理盐水
剂量	~0.25毫克/千克
给药方式	i.p.

➤ 参考文献:

- 1.Pignatello MA, et al. Toxicol Appl Pharmacol. 1997, 142(2), 319-327.
- 2.Pignatello MA, et al. Toxicol Appl Pharmacol. 1999, 159(2), 109-116.
- 3.Wu K, et al. Breast Cancer Res Treat. 2006, 96(2), 147-157.
- 4.Louisse J, et al. Toxicol Lett. 2011, 203(1), 1-8.
- 5.Darro F, et al. Breast Cancer Res Treat. 1998, 51(1), 39-55.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD7230-10mM	TTNPB (RAP激动剂)	10mM×0.2ml
SD7230-5mg	TTNPB (RAP激动剂)	5mg
SD7230-25mg	TTNPB (RAP激动剂)	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成高浓度的储备液(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