

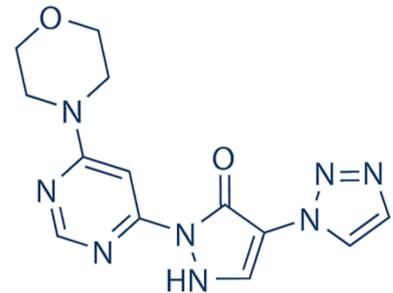
## Molidustat (HIF抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1211-10mM	Molidustat (HIF抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1211-5mg	Molidustat (HIF抑制剂)	5mg
SC1211-25mg	Molidustat (HIF抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-(6-morpholin-4-ylpyrimidin-4-yl)-4-(triazol-1-yl)-1H-pyrazol-3-one
简称	Molidustat
别名	BAY85-3934, BAY-85-3934, BAY 85-3934, BAY 853934, BAY853934, BAY-853934
中文名	N/A
化学式	C <sub>13</sub> H <sub>14</sub> N <sub>8</sub> O <sub>2</sub>
分子量	314.3
CAS号	1154028-82-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 6mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.59ml DMSO, 或每3.14mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1211-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Molidustat (BAY 85-3934)是一类高效的缺氧诱导因子脯氨酸羟化酶(HIF-PH)抑制剂, 其对PHD1、PHD2和PHD3的IC50分别为480nM、280nM和450nM。Phase 2。				
信号通路	Angiogenesis; Epigenetics				
靶点	PHD2	PHD3	PHD1	—	—
IC50	280nM	450nM	480nM	—	—
体外研究	在体外实验中, Molidustat诱导了HeLa、A549和Hep3B细胞中缺氧敏感基因的转录。				
体内研究	在健康的大鼠和猕猴模型中, Molidustat(1.5mg/kg, p.o.)诱导了剂量依赖性的EPO及红细胞生成。在gentamicin诱导的肾性贫血大鼠中, Molidustat(5mg/kg, p.o.)提升了红细胞积压水平, 刺激了内源性EPO的产生, 同时并没有升压作用。				
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	生物素化的HIF-1α 556-574(biotinyl-DLDLEmlAPYIPMDDDFQL)结合到白色的用Blocker Casein预封闭的96孔NeutrAvidin高亲和力平板上,随后用1mM的biotin封闭。被固定的肽类底物用正确数量的HIF-PH以及终体积100μl的含有20mM Tris(pH 7.5), 5mM KCl, 1.5mM MgCl <sub>2</sub> , 20μM 2-oxoglutarate, 10μM FeSO <sub>4</sub> , 2mM ascorbate, 4% protease inhibitors 不含EDTA的缓冲液孵育, 加上合适浓度的被测化合物。反应时间是60分钟。用冲洗缓冲液洗三次来终止反应。羟化的生物素HIF-1α 556-574用含有Eu-VBC, 50mM Tris[pH 7.5], 120mM NaCl的100μl结合缓冲液室温孵育60分钟。用DELFLIA冲洗缓冲液洗六次后, 加入100μl的增强溶液, 结合VBC的量通过时间分辨荧光分析法来测量。测量至少三次, 结果用means±SEM表示。IC50用GraphPad Prism software得出。当需要调整游离的Fe <sup>2+</sup> , 反应缓冲液要加入适量的(NH <sub>4</sub> ) <sub>2</sub> Fe(SO <sub>4</sub> ) <sub>2</sub> ·6H <sub>2</sub> O。

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A

处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	gentamicin诱导的肾性贫血大鼠
配制	ethanol:Solutol HS 15:water (10:20:70)
剂量	5mg/kg
给药方式	p.o.

➤ **参考文献:**

1.Flamme I, et al. PLoS One. 2014, 9(11), e111838.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1211-10mM	Molidustat (HIF抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1211-5mg	Molidustat (HIF抑制剂)	5mg
SC1211-25mg	Molidustat (HIF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