

Zibotentan (ZD4054)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Zibotentan (ZD4054)	53436ES08	5 mg

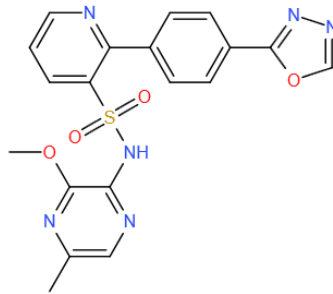
产品描述

Zibotentan (ZD4054) 是一种高效的、具有口服活性的、特异性的内皮素 A (ETA)受体拮抗剂 (Endothelin A 拮抗剂; ETA 拮抗剂), 其 IC₅₀ 为 21 nM, Ki 值为 13 nM。Zibotentan 抑制肿瘤细胞增殖, 诱导细胞凋亡, 具有抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	ZD-4054
中文名称 (Chinese Name)	内皮素受体拮抗剂
靶点 (Target)	ETA
通路 (Pathway)	GPCR/G Protein--Endothelin Receptor
CAS 号 (CAS NO.)	186497-07-4
分子式 (Formula)	C ₁₉ H ₁₆ N ₆ O ₄ S
分子量 (Molecular Weight)	424.43
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

Zibotentan (1 μ M; 24 小时) 显著抑制血清饥饿处理的 HEY、OVCA 433、SKOV-3 和 A-2780 的细胞增殖, 诱导凋亡细胞的增加, 抑制 bcl-2 并激活 caspase-3 和聚 (ADP-核糖) 聚合酶蛋白, 下调 HEY 细胞中两种激酶 (AKT 和 p42/44MAPK) 的内源性的 ET-1 诱导的磷酸化/活化。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

Zibotentan (10 mg/kg, 腹腔注射, 21 天) 治疗显著抑制小鼠肿瘤生长, 上调 E-钙粘蛋白表达水平。^[2]

参考文献

[1] Laura Rosanò, et al. ZD4054, a specific antagonist of the endothelin A receptor, inhibits tumor growth and enhances paclitaxel activity in human ovarian carcinoma in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther.* 2007 Jul;6(7):2003-11.

[2] Laura Rosanò, et al. Acquisition of chemoresistance and EMT phenotype is linked with activation of the endothelin A receptor pathway in ovarian carcinoma cells. *Clin Cancer Res.* 2011 Apr 15;17(8):2350-60.