

产品名称：地喹氯铵

产品别名：**Dequalinium Chloride**

生物活性:	
Description	Dequalinium Chloride 是一种 PKC 抑制剂, IC50 为 7-18 μM , 同时也是一种选择性蜂毒明肽敏感型钾离子通道阻断剂, IC50 为 1.1 μM .
IC ₅₀ & Target	PKC [1] 7 μM -18 μM
In Vitro	Dequalinium chloride (DECA)是一种阳离子亲脂性化合物, 结构与染料若丹明 123 相似。DECA 选择性积累, 并保留在肿瘤细胞的线粒体中, 其通过阻断线粒体酶而充当线粒体毒药, 随后扰乱细胞能量的产生, 最终导致细胞死亡。Dequalinium Chloride 是神经节传导阻滞剂(EC50 = 2 μM)。[1] Dequalinium 是蜂毒明肽敏感的肝细胞中钾离子通道的有效抑制剂, 也是骨骼肌中烟碱响应的有效抑制剂。Dequalinium 阻断血管紧张素 II 诱发的钾离子损失, IC50 为 1.5 μM , 抑制 125I-monoiodoapamin 的结合, Ki 为 1.1 μM 。[2] 在培养的大鼠交感神经元中, Dequalinium 对缓慢蜂毒明肽敏感的后超极化(AHP)成分能够快速可逆地抑制, 随后产生一个单一的动作电位。[3] Dequalinium Chloride (DECA)是一种阳离子亲脂性 PKC 抑制剂。当暴露在 UV 光下时, DECA 共价结合并不可逆地抑制 PKC α 和 PKC β 。[4]
In Vivo	在荷负膀胱 MB49 肿瘤的小鼠体内, Dequalinium chloride (2 mg/kg/d, i.p.)表现出抗癌活性, T/C 为 210%。[5]
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 0.025 mg/mL (0.05 mM) Ethanol : insoluble Water : insoluble
References	[1] Manetta A, et al. Gynecol Oncol, 1993, 50(1), 38-44. [2] Castle NA, et al. Eur J Pharmacol, 1993, 236(2), 201-207. [3] Dunn PM, et al. Eur J Pharmacol, 1994, 252(2), 189-194. [4] Rotenberg SA, et al. J Biol Chem, 1998, 273(4), 2390-2395. [5] Weiss MJ, et al. Proc Natl Acad Sci U S A. 1987, 84(15), 5444-5448.
实验参考:	
Animal Administration	动物实验: [5] Animal Models: Mice bearing bladder MB49 tumors Formulation: Dissolved in water using a bath sonicator Dosages: 2 mg/kg/d Administration: i.p.
References	[1] Manetta A, et al. Gynecol Oncol, 1993, 50(1), 38-44. [2] Castle NA, et al. Eur J Pharmacol, 1993, 236(2), 201-207. [3] Dunn PM, et al. Eur J Pharmacol, 1994, 252(2), 189-194. [4] Rotenberg SA, et al. J Biol Chem, 1998, 273(4), 2390-2395. [5] Weiss MJ, et al. Proc Natl Acad Sci U S A. 1987, 84(15), 5444-5448.