

Catalog Number: CM00610

产品信息

Catalog Number:
CM00610

CAS号:
488832-69-5

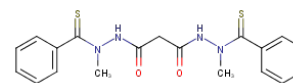
分子式:
 $C_{19}H_{20}N_4O_2S_2$

主要靶点:
Apoptosis|HSP|Reactive Oxygen Species

主要通路:
NF- κ B信号通路|凋亡|代谢|免疫与炎症|细胞骨架

分子量:
400.5

溶解度:
Ethanol:<1 mg/mL,DMSO:74 mg/mL (184.8 mM)



体外活性

在携带人乳腺癌(MDA435, MCF7和ZR-75-1),肺癌(RER)或淋巴瘤(U937)的裸鼠模型中,尽管 Elesclomol (25-100 mg/kg) 单独处理没有抗癌活性,但其可大幅增强如紫杉醇等疗药物的功效,可使肿瘤衰退,也可延长小鼠寿命。

体内活性

Elesclomol对SK-MEL-5、MCF-7和HL-60细胞的活力有明显抑制(IC₅₀: 110/24/9 nM)。Elesclomol可诱导酵母细胞铜依赖性的ROS生成和毒性,与作用于细胞内特定靶点不同,Elesclomol与电子传递链相互作用,电子传递链在细胞器中获得高水平的ROS,从而使细胞死亡。使用Affymetrix 基因芯片分析, Elesclomol (100 nM) 处理Hs294T细胞6小时,明显诱导热休克反应基因和金属硫蛋白基因的表达。 Elesclomol (100 nM) 处理Ramos Burkitt's淋巴瘤 B细胞1小时和6小时,可诱导Hsp70 RNA水平快速提高4.8倍和160倍,Elesclomol处理 0.5小时和6小时,ROS含量分别提高20%和385%,抗氧化剂N-乙酰半胱氨酸和Tiron预处理可抑制对Hsp70的诱导作用。Elesclomol (200 nM) 处理HSB2细胞18小时,通过诱导氧化应激,提高早期和晚期凋亡细胞分别为3.7和11倍。

细胞实验

Cells are treated with various concentrations of Elesclomol for 18 or 24 hours. The level of intracellular ROS is monitored using the DCFDA probe, which emits a green fluorescence on oxidation. Cell death is determined by flow cytometry of cells double stained with Annexin V/FITC and propidium iodide (PI) using a Vybrant Apoptosis assay kit.(Only for Reference)

描述

Elesclomol (STA-4783) is an effective oxidative stress inducer that elicits pro-apoptosis of tumor cells.

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 2 years