

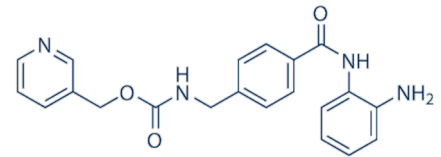
Entinostat (HDAC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD1083-10mM	Entinostat (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SD1083-5mg	Entinostat (HDAC抑制剂)	5mg
SD1083-25mg	Entinostat (HDAC抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	pyridin-3-ylmethyl N-[[4-[(2-aminophenyl)carbamoyl]phenyl]methyl]carbamate
简称	Entinostat
别名	MS-275, MS 275, MS275, SNDX-275, MS 27-275, MS-27-275, SNDX 275
中文名	恩替诺特
化学式	C ₂₁ H ₂₀ N ₄ O ₃
分子量	376.41
CAS号	209783-80-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 75mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.33ml DMSO, 或每3.76mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD1083-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Entinostat (MS-275)强烈抑制HDAC1和HDAC3, 无细胞试验中IC50分别为0.51μM和1.7μM, 抑制作用强于HDACs 4、6、8和10。Phase 3。				
信号通路	Epigenetics; DNA Damage; NF-κB				
靶点	HDAC1	HDAC3	—	—	—
IC50	0.51μM	1.7μM	—	—	—
体外研究	MS-275通过作用于2'-氨基而抑制HDACs。MS-275作用于K562细胞, 诱导p21WAF1/CIP1和凝溶胶蛋白的累积。MS-275作用于A2780细胞, 可以降低S期细胞、提高G1期细胞。MS-275通过抑制HAD而抑制人类肿瘤细胞系, 包括A2780、Calu-3、HL-60、K562、St-4、HT-29、KB-3-1、Capan-1、4-1St和HCT-15细胞增殖, IC50为41.5nM到4.71μM。MS-275抑制HDACs, 作用于HDAC1和HDAC3时IC50分别为0.51μM和1.7μM。而对其他的HDACs没有抑制效果, 如HDAC4、6、8和10。MS-275有效抑制人类白血病和淋巴瘤细胞, 包括U937、HL-60、K562和Jurkat。MS-275可以诱导U937细胞p21CIP1/WAF1调节的生长和变异Marker(CD11b)的表达。MS-275降低cyclin D1和抗凋亡蛋白Mcl-1与XIAP的表达。				
体内研究	MS-275按49mg/kg剂量作用于除了HCT-15的人类移植瘤都显示出强抗癌活性。MS-275促进恶性实体瘤和恶性血液病的治疗可能性, 及生理和畸变基因表达的调节。MS-275和IL-2联用, 作用于肾细胞癌显示出强抗癌活性, 因为降低调节性T细胞和增强脾细胞的表达。				
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	用HDAC buffer按1:6稀释鼠肝内的酶。重组人类HDACs按1:4稀释在HDAC buffer中。用于标准HDAC实验, 60μl HDAC buffer和10μl稀释的酶溶液在30°C混合。在HDAC buffer中加入30μl基底液开始HDAC反应, 随后在30°C下温育30分钟。加入100μl胰蛋白酶溶液终止反应, 胰蛋白酶溶液由溶于50mM Tris-HCl(pH为8.0)的10mg/ml胰蛋白酶, 100mM NaCl及2μM TSA组成。30°C下温育20分钟, 通过测定460纳米(λex=390nm)处的荧光监测AMC的释放。使用释放的AMC校准荧光强度。用于标准时间过程实验, 在初始100μl HDAC反应中加入20pmol基底物。2-50pmol基底物的酶法分析产物获得荧光AMC, 通过测量这种荧光AMC来测定Km值和Vmax值。使用Hanes图分析实验数据。记录的AMC信号是针对没有酶

	而有buffer和基底物的空白区。
--	-------------------

细胞实验	
细胞系	A2780, Calu-3, HL-60, K562, St-4, HT-29, KB-3-1, Capan-1, 4-1St和HCT-15细胞
浓度	10 μ M左右
处理时间	3天
方法	5 \times 10 ³ 个肿瘤细胞接种到96孔板上, 加入梯度浓度MS-275培养三天。细胞用0.1mg/ml中性红在CO ₂ 反应器中染色1小时, 测定中性红与50 μ l乙醇和150 μ l 0.1M Na ₂ HPO ₄ 溶解后的OD540, 测定IC50值。

动物实验	
动物模型	侧腹皮下注射A2780, HT-29, HTC-15, KB-3-1, 4-1St, St-4, Capan-1和Calu-3细胞的裸鼠
配制	溶于0.05N HCl, 0.1% Tween-80
剂量	12.3, 24.5和49mg/kg
给药方式	每天口服处理一次, 每周进行5天, 持续4周。

➤ **参考文献:**

- 1.Saito A, et al. Proc Natl Acad Sci USA, 1999, 96(8), 4592-4597.
- 2.Rosato RR, et al. Cancer Res, 2003, 63(13), 3637-3645.
- 3.Zhang ZY, et al. Neurosci, 2010, 169, 370-377.
- 4.Kato Y, Clin Cancer Res, 2007, 13(15), 4538-4546.
- 5.Wegener D, et al. Chem Biol, 2003, 10(1), 61-68.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD1083-10mM	Entinostat (HDAC抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SD1083-5mg	Entinostat (HDAC抑制剂)	5mg
SD1083-25mg	Entinostat (HDAC抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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的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