

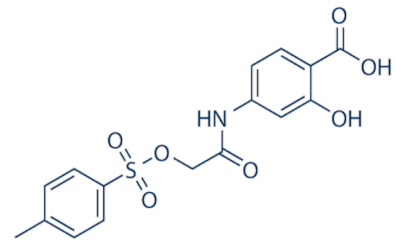
## NSC 74859 (STAT抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SD4794-10mM	NSC 74859 (STAT抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4794-5mg	NSC 74859 (STAT抑制剂)	5mg
SD4794-25mg	NSC 74859 (STAT抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-hydroxy-4-[[2-(4-methylphenyl)sulfonyloxyacetyl]amino]benzoic acid
简称	NSC 74859
别名	S3I-201, NSC-74859, NSC74859, S3I 201, S3I201
中文名	N/A
化学式	C <sub>16</sub> H <sub>15</sub> NO <sub>7</sub> S
分子量	365.36
CAS号	501919-59-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 73mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.37ml DMSO, 或每3.65mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SD4794-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	S3I-201有效抑制fSTAT3DNA结合活性, 无细胞试验中IC50为86μM, 对STAT1和STAT5抑制作用弱。				
信号通路	JAK/STAT; Stem Cells & Wnt				
靶点	STAT3	—	—	—	—
IC50	86μM	—	—	—	—
体外研究	S3I-201选择性抑制Stat3 DNA结合活性。S3I-201抑制Stat3-Stat3复合形式,不依赖于Stat3的激活状态。S3I-201不干涉Lck SH2与同源pTyr肽结合。S3I-201作用于NIH 3T3/v-Src鼠成纤维细胞和人类乳腺癌MDA-MB-231, MDA-MB-435和MDA-MB-468细胞, 可以抑制Stat3激活。S3I-201抑制Stat3依赖的转录活性。S3I-201也抑制编码cyclin D1, Bcl-xL和surviving的Stat3-调节基因的表达。S3I-201可以降低pS727STAT3水平和降低TGF-β通路蛋白水平。S3I-201也可抑制CD133 <sup>+</sup> 和CD133 <sup>-</sup> Huh-7细胞。最新研究显示S3I-201作用于Hep-G2、Huh-7和SK-HEP-1细胞, 加强Cetuximab的抗增殖效果。				
体内研究	5mg/kg剂量的S3I-201作用于携带人类乳腺癌(MDA-MB-231)的鼠时, 显示出强抑制效果。5mg/kg剂量的S3I-201作用于Huh-7移植瘤, 显示出强抗癌活性, 没有明显的外部健康改变或者体重减轻症状。				
临床实验	N/A				
特征	S3I-201是化学探测器抑制剂, 可以除去乳腺癌。				

#### ➤ 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	100ml生物素-e-Ac-EPQpYEEIEL-OH(溶于50mM Tris/150mM NaCl, pH为7.5)加到链霉亲和素包被的96孔微型板的每孔中, 在4°C下振荡温育过夜。用PBS/Tween-20冲洗板, 然后加入2次200ml BSA-T-PBS(0.2% BSA/0.1% Tween-20/PBS)。50ml Lck-SH2-GST融合蛋白(6.4ng/ml, 溶于BSA-T-PBS中)加到96孔板的每孔中, 在室温下振荡处理4小时。转移溶液, 用200ml BSA-T-PBS冲洗4次, 然后在每孔中加入100ml多克隆GST抗体(100ng/ml, 溶于BSA-T-PBS), 4°C下温育过夜。用BSA-T-PBS冲洗后, 在每孔中加入100ml 200ng/ml BSA-T-PBS辣根过氧化物酶结合的二抗, 然后在室温下温育45分钟。用BSA-T-PBS冲洗4步后, 再用PBS-T冲洗3步, 然后在每孔中加入100ml过氧化物酶底物, 温育5到15分钟。加入100ml 1M硫酸溶液终止过氧化物酶反应, 使用ELISA计数板在450nm处读取吸光值。

细胞实验	
细胞系	HCC细胞系包括HepG2、PLC/PRF/5、SNU-449、Huh-7、SNU-398、SNU-182和SNU-475

浓度	25到250μM
处理时间	72小时
方法	5×10 <sup>3</sup> 个细胞接种在含完全培养基的96孔微型板上。培养72小时后，每孔加入100μl 2mg/ml MTT溶液测量存活细胞数。2小时后，转移培养基，每孔加入100μl二甲亚砷溶解甲结晶。使用酶联免疫吸附法计数器在590nm处读取吸光值。

动物实验	
动物模型	6周大的携带MDA-MB-231移植瘤模型的雌性无胸腺裸鼠
配制	DMSO
剂量	5mg/kg
给药方式	静脉注射，每周2天或3天。

➤ **参考文献:**

- 1.Siddiquee K, et al. Proc Natl Acad Sci USA, 2007, 104(18), 7391-7396.
- 2.Lin L, et al. Oncogene, 2009, 28(7), 961-972.
- 3.Chen W, et al. Liver Int, 2012, 32(1), 70-77.
- 4.Sen N, et al. Proc Natl Acad Sci USA, 2012, 109(2), 600-605.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SD4794-10mM	NSC 74859 (STAT抑制剂)	10mM×0.2ml
SD4794-5mg	NSC 74859 (STAT抑制剂)	5mg
SD4794-25mg	NSC 74859 (STAT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成高浓度的储备液(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