

HB181207

Entinostat

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Entinostat	51405ES10	10 mg
Entinostat	51405ES50	50 mg

产品描述

Entinostat, 又称为 MS 275、SNDX 275, 是一种苯甲酰胺衍生物, 强烈抑制 HDAC1 ($IC_{50}=0.51 \mu M$) 和 HDAC3 ($IC_{50}=1.7 \mu M$), 对其他 HDACs 抑制作用较弱, 对 HDAC 4、6、8 和 10 的 IC_{50} 分别为 $>100 \mu M$ 、 $>100 \mu M$ 、 $82.5 \mu M$ 和 $94.7 \mu M$ 。Entinostat 有效作用于人白血病细胞和淋巴瘤细胞, Entinostat 降低细胞中 Bcl-XL 水平, 诱导 p21 蛋白表达, 导致细胞周期阻断 (G1 期), 并诱导细胞凋亡。另外, Entinostat 强效抑制裸鼠移植瘤生长。与其他药物联合使用, Entinostat 可以增强抗癌药物活性, 如 rituximab、gemcitabine、doxorubicin、sorafenib 和 bortezomib。

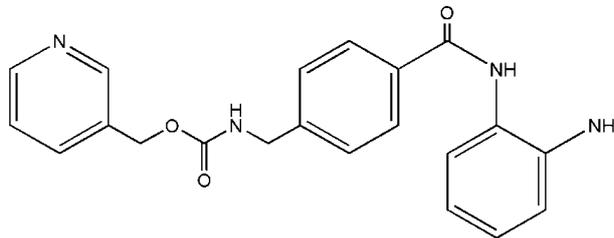
目前, Entinostat 已用于多种肿瘤的临床 Phase 3 期研究。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	MS 275, SNDX 275
化学名 (Chemical Name)	N-[[4-[[[(2-aminophenyl)amino]carbonyl]phenyl]methyl]-3-pyridinylmethyl ester, carbamic acid
靶点 (Target)	HDAC1/3
CAS 号 (CAS NO.)	209783-80-2
分子式 (Molecular Formula)	$C_{21}H_{20}N_4O_3$
分子量 (Molecular Weight)	376.41
外观 (Appearance)	结晶性粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (25 mg/ml)

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 $-20 \text{ }^{\circ}\text{C}$, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 $-20 \text{ }^{\circ}\text{C}$ 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

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) 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。】

相关实验（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外研究）

在 Entinostat (MS-27-275) 体外功能研究中，用不同浓度 MS-27-275 孵育从人白血病细胞中纯化的 HAD，MS-27-275 以剂量依赖地方式抑制 HAD， IC_{50} 约为 2.0 μ M。另外，0.3 或 1 μ M MS-27-275 引起高度乙酰化的 H4 聚集。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

体内实验中，建立移植瘤小鼠模型，包含 A2780、KB-3-1、HCT-15、4-1St、Calu-3、St-4、Capan-1 和 HT-29 共 8 种肿瘤细胞，分别给小鼠口服 MS-27-275（12.3、24.5 和 49 mg/kg）。49 mg/kg MS-27-275 对 KB-3-1、4-1St 和 St-4 表现出明显的抗肿瘤作用，对 Capan-1 表现出中等抗肿瘤作用。^[2]

参考文献

- [1] Tatamiya T, et al. Isozyme-selective activity of the HDAC inhibitor MS-275. *Proc Amer Assoc Cancer Res*, 45 (2004).
- [2] Saito A, et al. A synthetic inhibitor of histone deacetylase, MS-27-275, with marked in vivo antitumor activity against human tumors. *Proc Natl Acad Sci USA*, 96(8): 4592-4597(1999).
- [3] Rosato RR, et al. The histone deacetylase inhibitor MS-275 promotes differentiation or apoptosis in human leukemia cells through a process regulated by generation of reactive oxygen species and induction of p21CIP1/WAF1 1. *Cancer Res*. 63(13): 3637-3645 (2003).
- [4] Zhang ZY, et al. MS-275, an histone deacetylase inhibitor, reduces the inflammatory reaction in rat experimental autoimmune neuritis. *Neurosci*, 169(1): 370-377(2010).
- [5] Frys S, et al. Entinostat, a novel histone deacetylase inhibitor is active in B-cell lymphoma and enhances the anti-tumour activity of rituximab and chemotherapy agents. *British Journal of Haematology* 169(4): 506-519(2015).