

Cucurbitacin I 葫芦素 I

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Cucurbitacin I 葫芦素 I	53175ES03	1 mg
	53175ES08	5 mg

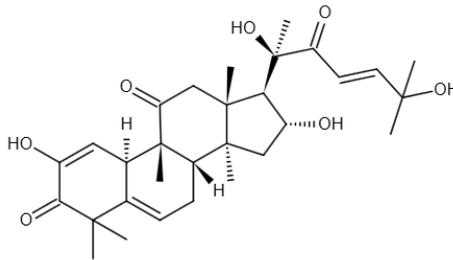
产品描述

Cucurbitacin I (葫芦素 I; Elatericin B; JSI-124; NSC-521777; JSI124; NSC521777) 是一种天然的 JAK2/STAT3 选择性抑制剂, 可有效抑制 STAT3 的磷酸酪氨酸水平、DNA 结合活性及其介导的基因表达, 但对 Src、AKT、ERK 和 JNK 无抑制作用。JAK/STAT3 信号通路在肿瘤的发生、发展中起着重要的调控作用, Cucurbitacin I 可诱导癌细胞凋亡, 具有有效的抗肿瘤活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	(8S,9R,10R,13R,14S,16R,17R)-17-[(E,2R)-2,6-dihydroxy-6-methyl-3-oxohept-4-en-2-yl]-2,16-dihydroxy-4,4,9,13,14-pentamethyl-8,10,12,15,16,17-hexahydro-7H-cyclopenta[a]phenanthrene-3,11-dione; Elatericin B; JSI-124; NSC-521777; JSI124; NSC521777
中文名称 (Chinese Name)	葫芦素 I
靶点 (Target)	STAT; JAK
通路 (Pathway)	JAK/STAT--STAT
CAS 号 (CAS NO.)	2222-07-3
分子式 (Formula)	C ₃₀ H ₄₂ O ₇
分子量 (Molecular Weight)	514.65
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

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. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 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。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

肉瘤作为一种罕见的恶性肿瘤，Cucurbitacin I 对于 5 种常见骨肉瘤细胞系 143B、MG63、HOS、SAOS-2、HUO 细胞均有明显的增殖抑制作用。^[1] Cucurbitacin I 通过抑制 VEGFR-2、成纤维细胞生长因子受体-1 (FGFR1) 和 STAT3 的磷酸化水平来抑制肿瘤血管生成。^[2] Cucurbitacin I 以剂量依赖性的方式抑制结肠癌细胞 COLO205 增殖，Cucurbitacin I (100 nM) 处理 6 h，COLO205 结肠癌细胞迁移 50%。COLO205 细胞暴露于 Cucurbitacin I 可显著降低细胞活力。在 COLO205 细胞中，Cucurbitacin I 可以抑制细胞的迁移和侵袭，并具有对结肠癌的化疗增敏活性。Cucurbitacin I 可抑制 STAT3 的激活、降低 MMP-9 的表达，100 nM Cucurbitacin I 降低了 STAT3 磷酸化和 MMP-9 表达的蛋白水平。结果表明，Cucurbitacin I 可能是结肠癌的一种有效的辅助化疗药物，具有抗迁移、抗入侵和化疗增敏活性。^[3]

（二）动物实验（体内实验）

与对照组小鼠相比，在小鼠中进行的体内 Matrigel 测定法显示，经 Cucurbitacin I 处理的小鼠的栓塞中的血管形成和血红蛋白含量显著降低。^[2] Cucurbitacin I (1 mg/kg/day) 能有效地抑制 A549 肿瘤、v-Src 转化的 NIH3T3 肿瘤和人乳腺癌 MDA-MB-468 裸鼠的肿瘤生长。用 Cucurbitacin I 处理 A549 和 MDA-MB-468 细胞可降低酪氨酸磷酸化 STAT3 的水平，A549 细胞比 MDA-MB-468 细胞更敏感。Cucurbitacin I 还可显著提高小鼠存活率。这些结果为 JAK/STAT3 信号通路在抗癌药物发现中的药理作用提供了有力的支持。^[4]

参考文献

- [1] Toru Oi, et al. STAT3 inhibitor, cucurbitacin I, is a novel therapeutic agent for osteosarcoma. 2016, 49(6):2275-2284.
- [2] Kim Hyeon Jin, Kim Jin-Kyung. Antiangiogenic effects of cucurbitacin-I. 2015, 38(2):290-8.
- [3] Song J, et al. Cucurbitacin I inhibits cell migration and invasion and enhances chemosensitivity in colon cancer. *Oncol Rep.* 2015 Apr;33(4):1867-71.
- [4] Blaskovich M A, et al. Discovery of JSI-124 (cucurbitacin I), a selective Janus kinase/signal transducer and activator of transcription 3 signaling pathway inhibitor with potent antitumor activity against human and murine cancer cells in mice[J]. *Cancer research*, 2003, 63(6): 1270-1279.