

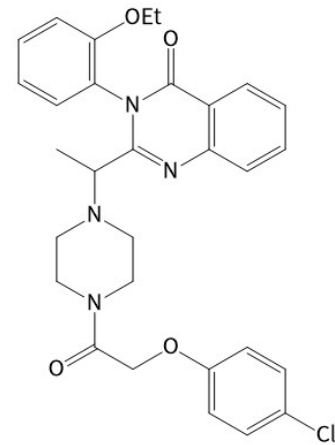
## Erastin (Ferroptosis诱导剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0224-5mg	Erastin (Ferroptosis诱导剂)	5mg
SC0224-25mg	Erastin (Ferroptosis诱导剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-[1-[4-[2-(4-chlorophenoxy)acetyl]piperazin-1-yl]ethyl]-3-(2-ethoxyphenyl)quinazolin-4-one
简称	Erastin
别名	2-[1-[4-[2-(4-氯苯氧基)乙酰基]-1-哌嗪基]乙基]-3-(2-乙氧基苯基)-4-(3H)喹唑啉酮
中文名	爱拉斯汀
化学式	C <sub>30</sub> H <sub>31</sub> ClN <sub>4</sub> O <sub>4</sub>
分子量	547.04
CAS号	571203-78-6
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	DMSO ≥12.5mg/ml, need ultrasonic; Water insoluble; Ethanol insoluble
溶液配制	2mg 加入 0.366ml DMSO, 或者每 5.470mg 加入 1ml DMSO, 配制成10mM溶液。Erastin在溶液中不稳定, 建议现配现用。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Erastin是一种细胞渗透性喹唑啉酮类(Quinazolinone)化合物, 常用作铁诱导的细胞死亡, 即铁死亡(Ferroptosis)诱导剂, 通过作用于线粒体VDAC而起作用。因对RAS突变的细胞具有选择性致死的作用, 也被称为RSL (RAS-selective lethal)化合物[1]。相较于其它铁死亡诱导剂, Erastin具有更有效, 作用更快, 效果更持久的特点[2]。			
信号通路	Anti-tumor; Ferroptosis; Mitochondrial dysfunction			
靶点	VDAC	System x <sub>c</sub> <sup>-</sup>	p53	
IC50/EC50	-	-	-	
体外研究	Erastin主要作用于线粒体电压依赖性阴离子通道(voltage-dependent anion channel, VDAC)而起诱导肿瘤细胞铁死亡的作用[3], 且亲和纯化实验表明VDAC2/3是Erastin作用直接的、必要的靶点[1,3]。Erastin和谷氨酸一样, 可抑制胱氨酸/谷氨酸逆向转运蛋白(System x <sub>c</sub> <sup>-</sup> )摄取胱氨酸, 破坏细胞氧化防御系统, 诱导铁依赖性的氧化死亡[4]。此外, Erastin还可通过激活p53促进铁死亡[2]。在Erastin处理的HT-29细胞中观察到线粒体通透膜转换孔(Mitochondrial permeability transition pore, mPTP)开放, 线粒体去极化和细胞色素C (Cytochrome C)释放[5]。使用Erastin处理原代异位子宫内膜间质细胞(Ectopic endometrial stromal cells, EESC)显著提高了细胞内总活性氧(Reactive oxygen species, ROS)水平、脂质ROS水平和铁水平, 电子显微镜观察结果显示EESC线粒体明显损伤[6]。Erastin作为一种新型抗癌药物具有巨大的潜力, 还可以增强许多癌细胞对各种化疗药物的敏感性, 对辐射的敏感性[2]。Erastin已被证明不仅能诱导肿瘤细胞发生非凋亡形式的死亡, 还能提高肺癌细胞对顺铂(Cisplatin)的敏感性[7]; 横纹肌肉瘤(Rhabdomyosarcoma)细胞对阿霉素(Doxorubicin)和放线菌素D (Actinomycin D)的敏感性[8]; 胶质母细胞瘤(Glioblastoma)细胞对替莫唑胺(Temozolomide)的敏感性[9]等。在HeLa和NCI-H1975肺癌细胞中, Erastin增强了X射线照射诱导的细胞死亡并诱导了铁死亡, 细胞内谷胱甘肽(Glutathione, GSH)浓度和GPX4 (Glutathione peroxidase 4)蛋白表达水平降低[10]。			
体内研究	研究发现, 在子宫内膜异位症的C57BL/6小鼠模型中, 经Erastin给药的小鼠异位病变消退[3]; 将NCI-H1975肺癌细胞移植到裸鼠左肩, Erastin对肿瘤移植小鼠模型的治疗显示了放射增敏效应, 肿瘤内GSH浓度降低[7]。			
临床实验	N/A			

特征	Erastin选择性地诱导RAS突变的肿瘤细胞发生非凋亡形式的铁依赖的细胞死亡，并伴随细胞氧化，还具有化疗药物和放射增敏的效果[3,7]。
----	-----------------------------------------------------------------------

➤ 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	N/A

细胞实验	
细胞系	HT-29, DLD-1, Caco-2 and NCM460 cells
浓度	0.1μM, 1μM, 10μM, 30μM
处理时间	24h, 48h, 72h, 96h
方法	Cell survival was measured by MTT assay; Cell proliferation was tested by BrdU incorporation assay.

动物实验	
动物模型	Female BALB/c nu/nu mice
配制	5% DMSO/corn oil
剂量	15mg/kg/day for 3 days at 24h intervals
给药方式	i.p.

➤ 参考文献:

1. Yagoda N, von Rechenberg M, Zaganjor E, Bauer AJ, Yang WS, Fridman DJ, Wolpaw AJ, Smukste I, Peltier JM, Boniface JJ, et al. Nature. 2007. 447:864-868.
2. Zhao Y, Li Y, Zhang R, Wang F, Wang T, Jiao Y. Onco Targets Ther. 2020. 13:5429-5441.
3. Yang Y, Luo M, Zhang K, Zhang J, Gao T, Connell DO, Yao F, Mu C, Cai B, Shang Y, Chen W. Nat Commun. 2020. 11(1):433.
4. Dixon SJ, Lemberg KM, Lamprecht MR, Skouta R, Zaitsev EM, Gleason CE, Patel DN, Bauer AJ, Cantley AM, Yang WS, Morrison B 3rd, Stockwell BR. Cell. 2012. 149(5):1060-72.
5. Huo H, Zhou Z, Qin J, Liu W, Wang B, Gu Y. PLoS One. 2016. 11(5):e0154605.
6. Li Y, Zeng X, Lu D, Yin M, Shan M, Gao Y. Hum Reprod. 2021. 36(4):951-964.
7. Yamaguchi H, Hsu JL, Chen CT, Wang YN, Hsu MC, Chang SS, Du Y, Ko HW, Herbst R, Hung MC. Clin Cancer Res. 2013. 19(4):845-54.
8. Pennafort VPDS, Queiroz MVO, Gomes ILV, Rocha MFF. Rev Bras Enferm. 2018. 71(suppl 3):1334-1342.
9. Chen L, Li X, Liu L, Yu B, Xue Y, Liu Y. Oncol Rep. 2015. 33(3):1465-74.
10. Shibata Y, Yasui H, Higashikawa K, Miyamoto N, Kuge Y. PLoS One. 2019. 14(12):e0225931.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0224-5mg	Erastin (Ferroptosis诱导剂)	5mg
SC0224-25mg	Erastin (Ferroptosis诱导剂)	25mg

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于DMSO，建议分装后-80°C保存，预计至少1个月内有效。

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2,000-10,000×g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降于管底后再开盖使用。
2. 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、体内研究结果或其它相关文献，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 2022.03.11