

曲古柳菌素 A(TSA) ; Trichostatin A from Streptomyces sp

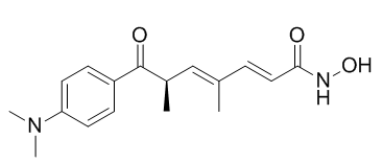
产品编号 : MB5445

质量标准 : >98%,进分

包装规格 : 1mg

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C17H22N2O3	结 构 式	
分子量	302.4		
CAS No.	58880-19-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 23 mg/mL		
	Water Insoluble		
	Ethanol Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介 : 曲古抑菌素 A Trichostatin A 是有效的, 特异的组蛋白去乙酰化酶类型 I 和 II (HDAC class I/II) 抑制剂。

别名 : 2,4-Heptadienamide, 7-[4-(dimethylamino)phenyl]-N-hydroxy-4,6-dimethyl-7-oxo-, (2E,4E,6R)-

物理性状及指标

外观 :白色至卡其色固体

溶解性 :DMSO 23 mg/mL ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>98%

熔点 :144 °C (dec.)

密度 :1.14 g/cm³

IC50 :HDAC (组蛋白去乙酰化酶) 1 的活性 : IC50 = 70 nM ;

.....IL-2 基因的表达 : IC50 = 73 nM (Jurkat cells)

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性：

Trichostatin A (TSA)是一种 HDAC 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 1.8 nM 左右。作用靶点：

HDAC

(Cell-free assay)~1.8 nM

体外研究 Trichostatin A 抑制八种乳腺癌细胞系，包括 MCF-7, T-47D, ZR-75-1, BT-474, MDA-MB-231, MDA-MB-453, CAL 51, 和 SK-BR-3 增殖，平均 IC50 为 124.4 nM (范围为 26.4-308.1 nM),作用于表达 ER α 的细胞系比作用于表达 ER α 阴性的细胞系更有效。Trichostatin A 作用于全部乳腺癌细胞系，抑制 HDAC 活性，平均 IC50 为 2.4 nM (范围为 0.6-2.6 nM), 产生显著的组蛋白 H4 高度乙酰化。与 Trapoxin (TPX) 和 Chlamydocin 有效抑制 HDAC1 或 HDAC4 而不是 HDAC6 不同，Trichostatin A 抑制这些 HDACs，且抑制程度相似，IC50 分别为 6 nM, 38 nM, 和 8.6 nM。Trichostatin A (100 ng/mL) 作用于 MIA PaCa-2 细胞，通过招募 p300 和 PCAF 进入 Sp1-NF-Y HDAC 复合物，而诱导转化生长因子 β II型受体(T β R II) 表达，复合物与 T β R II 启动子的 DNA 片段结合，伴随着 Sp1 乙酰化，且与复合物相关的 HDAC 数量全部降低。

体内研究 Administration of Trichostatin A 按 0.5 mg/kg 剂量处理 N-甲基-N-亚硝基脲致癌物诱发的大鼠乳腺癌模型，持续处理 4 周，具有有效的抗癌活性，即使按高达 5 mg/kg 剂量处理也没有任何可测量到的毒性。Trichostatin A 按 10 mg/kg 剂量单独腹腔注射给药非转基因和脊髓性肌萎缩症 (SMA) 模型鼠，导致乙酰化的 H3 和 H4 组蛋白水平提高，也导致活运动神经元(SMN) 基因表达稍微提高。Trichostatin A 每天按 10 mg/kg 剂量处理 SMA 模型鼠，促进存活，减轻体重下降，且增强运动行为。

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。曲古抑菌素 A 是组蛋白脱乙酰酶 (HDAC) 特异性抑制剂，IC50 值为 1.8 nM。

靶点 HDAC [1](Cell-free assay)~1.8 nM

储液配置：

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.3069 mL	16.5344 mL	33.0688 mL
5 mM	0.6614 mL	3.3069 mL	6.6138 mL
10 mM	0.3307 mL	1.6534 mL	3.3069 mL
50 mM	0.0661 mL	0.3307 mL	0.6614 mL

使用方法推荐 (仅供参考)

激酶实验举例：

体外 HDAC 活性：

✚ 从每种乳腺癌细胞系(MCF-7, T-47D, ZR-75-1, BT-474, MDA-MB-231, MDA-MB-453, CAL 51,或 SK-BR-3)中准备全部细胞提取物。在溶于 0.1% (v/v)乙醇的不同浓度 Trichostatin A 存在时，或者

使用 0.1% (v/v)乙醇作为对照, 20 μ L 细胞粗提取物($\sim 2.5 \times 10^5$ 个细胞)与 1 μ L $\sim 1.5 \times 10^6$ cpm [3H]乙酰标记的组蛋白 H4 肽底物(第 2-20 位 NH₂-末端残基) 在 25°C 下温育 60 分钟。使用 50 μ L 1 M HCl/0.16 M 乙酸对每组 200- μ L 反应进行淬灭, 然后使用 600 μ L 乙酸乙酯进行抽提, 通过闪烁计数器测量释放的[3H]乙酸。使用非线性回归曲线拟合抑制数据, 绘制合适的剂量反应曲线, 而测定 IC₅₀。

细胞实验举例：

- ✦ Cell lines: MCF-7, T-47D, ZR-75-1, BT-474, MDA-MB-231, MDA-MB-453, CAL 51, 和 SK-BR-3
- ✦ Concentrations: 溶于无水酒精,终浓度为 $\sim 10 \mu$ M
- ✦ Incubation Time: 96 小时
- ✦ Method: 使用不同浓度 Trichostatin A 处理细胞 96 小时。处理后,使用 sulforhodamine B 比色分析测定细胞增殖。通过台酚蓝染色排除法测定细胞活力。

动物实验举例：

- ✦ Animal Models: 携带 NMU 诱导的肿瘤的近交系(Ludwig/Wistar/Olac)处小鼠
- ✦ Formulation: 溶于 DMSO
- ✦ Dosages: ~ 5 mg/kg/day
- ✦ Administration: 皮下注射

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

参考文献

- [1] Furumai R, et al. Proc Natl Acad Sci U S A, 2001, 98(1), 87-92.
- [2] Kim MS, et al. Cancer Res, 2003, 63(21), 7291-7300.
- [3] Huang W, et al. J Biol Chem, 2005, 280(11), 10047-10054.
- [4] Avila AM, et al. J Clin Invest, 2007, 117(3), 659-671.