

Catalog Number: CM00596

产品信息

Catalog Number:
CM00596

CAS号:
496775-61-2

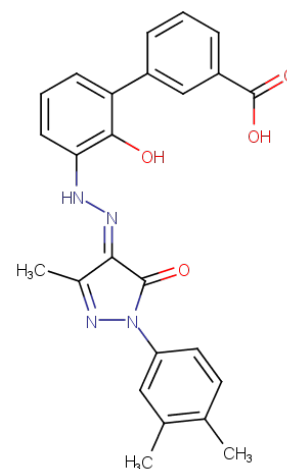
分子式:
 $C_{25}H_{22}N_4O_4$

主要靶点:
Thrombin

主要通路:
蛋白酶体

分子量:
442.47

溶解度:
Ethanol:< 1 mg/mL (insoluble or slightly soluble); DMSO:4.42 mg/mL (10 mM); H₂O:< 1 mg/mL (insoluble or slightly soluble)



体外活性

Eltrombopag在经过转染的含luciferase报告基因的鼠BAF3细胞 (BAF3/IRF-1/hTpoR) 中展现了0.27 μ M的半最大有效浓度 (EC₅₀)。它通过与金属离子 (例如, Zn²⁺) 和TpoR跨膜及近膜区域的特定氨基酸结合来激活受体。在N2C-Tpo细胞中, Eltrombopag (30 μ M) 通过Western blot上的抗磷酸化STAT5抗体检测, 实现了STAT5的激活。Eltrombopag在使用BrdU检测方法对BAF3/hTpoR细胞进行的2天孵育后, 以0.03 μ M的EC₅₀促进增殖。此外, Eltrombopag还促进了造血干细胞向致定向巨核细胞前体细胞的分化。Eltrombopag使骨髓CD34⁺细胞向CD41⁺巨核细胞的分化以剂量依赖方式增加, EC₅₀为0.1 μ M。[1] Eltrombopag抑制N2C-Tpo细胞和HEL92.1.7细胞增殖, IC₅₀分别为20.7 μ g/mL和2.3 μ g/mL。[2] Eltrombopag (20 μ g/mL) 导致细胞分裂速率减慢, 细胞周期G(1)期阻滞, 并在人和鼠白血病细胞中增加分化。Eltrombopag (5 μ g/mL) 在HL60细胞中显示了明显的分化迹象, 核内容组织的显著变化以及细胞质/核比例的增加。Eltrombopag (5 μ g/mL) 在U937细胞和URE细胞中引起了CD11b的增加, 这与前巨噬细胞状态一致。在HL60细胞中, Eltrombopag以剂量依赖的方式减少了白血病细胞中的自由细胞内铁量。[3]

体内活性

Eltrombopag (每日10 mg/kg) 在最后一剂后大约1周内, 使一只黑猩猩的血小板数量增加了两倍以上, 而对另外两只黑猩猩则增加了约1.5倍。[1] Eltrombopag (1 mg/mL) 延长了白血病小鼠模型的生存时间。[3]

储存

Powder: -20°C for 3 years | In solvent: -80°C for 1 year | Shipping with blue ice.