

Catalog Number: CM04424

产品信息

Catalog Number:
CM04424

CAS号:
950762-95-5

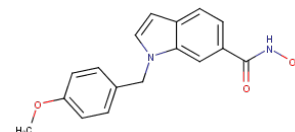
分子式:
C₁₇H₁₆N₂O₃

主要靶点:
HDAC|Apoptosis

主要通路:
DNA 损伤和修复|表观遗传|凋亡

分子量:
296.32

溶解度:
DMSO:15 mg/mL (50.62 mM);1eq.
NaOH:5.9 mg/mL (20 mM)



靶点活性

HDAC8:10 nM

体外活性

PCI-34051对HDAC8具有良好的活性 (Ki: 10 nM)，并且相较于其他一类HDACs (包括HDAC1) 显示出约5倍的高特异性。与HDAC1/6相比，PCI-34051的选择性高达200倍；与HDAC2/3//10相比，选择性更是高出1000倍。在对卵巢肿瘤细胞系OVCAR-3的研究中，PCI-34051展示出6 μM的GI50值和15%的细胞死亡率。在处理敏感细胞系时，24小时内或更早时间点，观察不到明显的微管蛋白或组蛋白乙酰化 (<25 μM)。PCI-34051诱导的凋亡依赖于卡帕斯；在用5 μM PCI-34051处理后的不同时间点测量卡帕斯-3活性时，从12小时到24小时再到48小时，活性呈现增加趋势。PCI-34051不促进Bid蛋白的裂解。而J.RT3-T.5和P116对PCI-34051敏感，缺乏PLC γ 1的J.gamma1细胞线则明显减少了PCI-34051诱导的凋亡程度。此外，稳态钙水平强烈影响PCI-34051诱导的凋亡。PCI-34051促使细胞色素c从线粒体释放。

体内活性

给予PCI-34051和Dexamethasone可以减少哮喘中的嗜酸性炎症和气道高反应性，从而减少气道重塑[2]。

细胞实验

Cell lines: A549 cell line, Ovar-3 cell line. Concentrations: 5 μM. Incubation Time: 24 hours. Method: Tumor cell lines and human umbilical vein endothelial cells are cultured for at least two doubling times, and growth is monitored at the end of PCI-34051 exposure using an Alamar Blue fluorometric cell proliferation assay as recommended by the manufacturer. PCI-34051 is assayed in triplicate wells in 96-well plates. The concentration required to inhibit cell growth by 50% (GI50) and 95% confidence intervals are estimated from the nonlinear regression using a four-parameter logistic equation.

储存

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