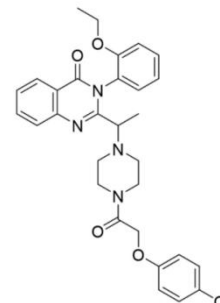


Erastin

基本信息

Cat.No.:	US0007A	1mg
	US0007B	1mg×5
	US0007C	50mg
	US0007D	1g
质量标准:	≥98%,BR	
CASNo.:	571203-78-6	
分子式:	C ₃₀ H ₃₁ ClN ₄ O ₄	
分子量:	547.04	
别名:	2-[1-[4-[2-(4-chlorophenoxy)acetyl]-1-piperazinyl]ethyl]-3-(2-ethoxyphenyl)-4(3H)-Quinazolinone	
作用通路:	Apoptosis / Membrane Transporter/Ion Channel	
作用靶点:	Ferroptosis / VDAC	
外观:	白色至类白色粉末	
储存条件:	2-8℃, 避光防潮密闭干燥	
运输条件:	常温运输	



溶解性数据

体外实验

溶解性(25℃): DMSO: 19mg/ml; 水、乙醇中不溶解				
制备储备液	浓度 \ 溶剂体积 \ 质量	1mg	5mg	10mg
	1mM	1.8280mL	9.1401mL	18.2802mL
	5mM	0.3656mL	1.8280mL	3.6560mL
	10mM	0.1828mL	0.9140mL	1.8280mL
*请参考溶解度信息来选择合适的溶剂配制储备液。配成溶液后, 请分装保存, 避免反复冻融。 *Purescix 内部测试了所有化合物的溶解度, 若实际溶解度与公布的值略有不同为正常现象, 是由于批次之间的轻微差异造成的, 请适当调整之后使用。				

体内实验 (现用现配)	10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline 此方案可获得: ≥ 1 mg/mL (1.83 mM); 澄清溶液	以 1mL 工作液为例, 取 100 μL 10mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400μLPEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50μLTween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450μL 生理盐水定容至 1mL。
	*以上溶解方案请先按照上述体外实验溶解数据配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂。 *以上溶剂前显示的百分比是指该溶剂在终溶液中的体积占比。 *以上溶解方案仅供参考, 您根据实验动物和给药方式进行适当的调整。 *体内实验的工作液, 建议现用现配, 当天使用。 *如果在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶。	

生物活性

【来源于公开文献, 仅供参考】

产品描述	Erastin 是一种能穿透细胞膜的铁死亡 (ferroptosis) 激活剂和抗肿瘤药物, 通过作用于线粒体 VDAC 而起作用, 选择性作用于携带致癌基因 RAS 的肿瘤细胞。Erastin 通过直接结合电压依赖性阴离子通道 (VDAC2/VDAC3) 改变外线粒体膜的渗透性, 从而诱导铁死亡, 并降低 NADH 氧化速率。另外, Erastin 及其类似物通过系统 xc-特异性抑制半胱氨酸的摄取, 并在各种细胞环境中触发铁死亡, 比 SAS 更具有强大的作用。除了产生针对性效果外, Erastin 还可以增强某些癌细胞的化疗、靶向治疗和免疫治疗效果, 表明 Erastin 在癌细胞治疗中具有潜在作用。
IC50	IC50: 11.58 μM (HCC1937) IC50: 0.20 μM (HT-1080) IC50: 0.14 μM (Calu-1)
体外研究	【来源于公开文献, 仅供参考】 Erastin (10μM; 24 小时) 触发异位子宫内膜间质细胞 (EESC) 的铁死亡, 并在 9 小时增加总 ROS 水平 ^[1] 。



(In Vitro)	Erastin 能够缩短 EESC 细胞中的线粒体长度并增加它的膜密度^[1]。 Erastin (10μM; 9 小时) 降低铁相关蛋白的 mRNA 表达水平, 例如 EESC 中的 FPN (铁输出蛋白)。然而, Erastin 诱导的 EESCs 铁死亡能够被 FPN 的过表达显著抑制^[1]。 Erastin (10μM; 24 小时) 在 HT-29 结直肠癌细胞中诱导线粒体通透性转换孔 (mPTP) 打开^[2]。 Erastin (30μM; 72 小时) 显著抑制 HT-29 结直肠癌细胞的生长^[2]。 Erastin 诱导铁死亡的分子机制与调节铁或线粒体脂肪酸代谢的基因有关。包括核糖体蛋白 L8、铁反应元件结合蛋白 2 (IREB2)、ATP 合酶 F0 复合亚基 C3、柠檬酸合酶、四肽重复结构域 35 和酰基辅酶 A 合成酶家族成员 2 (ACSF2)^[3]。 Note: 1. 不同细胞系对同种药物的敏感程度可能会有所差别, 经文献报道, A549、HCT116、HepG2、H1299 细胞系可能对 Erastin 不敏感^{[3][4][5]}。 2. 该产品在溶液状态不稳定, 建议您现用现配, 即刻使用。
体内研究 (In Vivo)	【来源于公开文献, 仅供参考】 Erastin 可用于动物建模, 构建铁死亡诱导模型。 Erastin (40mg/kg; 腹腔注射; 每 3 天一次, 持续 2 周) 抑制小鼠子宫内膜异位症模型中的子宫内膜异位植入, 表明 Erastin 通过触发铁死亡使异位病变消退^[1]。 Erastin (10mg/kg、30mg/kg; 腹腔注射; 每天一次, 持续 4 周) 抑制 SCID 小鼠的 HT-29 异种移植生长, 在 30mg/kg 处理下具有更有效的疗效^[2]。

实验方法

【来源于公开文献, 仅供参考】

	细胞系	实验类型	给药浓度	孵育时间	活性描述	PubMed
体外实验	143B/BJeHLT/BJeLR/Calu-1/HT-1080	cell viability assay	10nM-10μM	72 h	Erastin inhibited cystine uptake via system xc- and triggered ferroptosis in a variety of cellular contexts.(HT-1080: erastin IC50 = 0.20 μM; Calu-1: erastin IC50 = 0.14 μM)	24844246
	SKOV3	cell viability assay	5-20 μM	1-7 days	erastin-induced ferroptosis	31819185
	OVCA429	cell viability assay	5-20 μM	1-7 days	erastin-induced ferroptosis	31819185
	HT-22 neuron	cell viability assay	500 nM	16 h	leading to the depletion of intracellular cysteine and glutathione (GSH), and thus disrupting glutathione peroxidase 4 (GPx4) activity.	37536459
	NCI-H508	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	LoVo	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased cell viability	36823108
	LS513	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	SW480	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	SW620	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	SW1116	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	DLD-1	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	Caco-2	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	HT-29	cell viability assay	2.5-40 μM	48 h	Erastin significantly decreased CRC cell viability	36823108
	Pfa1	cell viability assay	0.1-5 μM	48 h	Dose-dependent toxicity	31634899
	HT-1080	cell viability assay	0.1-5 μM	48 h	Dose-dependent toxicity	31634899
	MAD-MB-231	cell viability assay	0-100 μM	72 h	IC50: 9.55 μM	36130940
	HCC1937	cell viability assay	0-100 μM	72 h	IC50: 11.58 μM	36130940

	动物种类	给药剂量	给药方式	结果
体内实验 (现用现配)	severe combined immunodeficient (SCID) mice	30 mg/kg	intraperitoneal injection	dramatically inhibited HT-29 xenograft growth
	C57BL/6 female mice	40 mg/kg	intraperitoneal injection	the administration of erastin reduced the volume of endometriotic-like lesions in mouse model with endometriosis
	Adult nude mice	30 mg/kg	intraperitoneal injection	effectively reduced the tumor sizes with decreased expression levels of GPX4, SOD1 and CAT
	BALB/c nude mice (colorectal cancer)	10 mg/kg	intraperitoneal injection	Erastin inhibited ALDH1 activity, and reduced sphere size and number in colorectal cancer cells.



注意事项

1. 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理（如 0.22 μ m 滤膜过滤），除去热原细菌，否则会导致染菌。
2. 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。
3. 科研试剂，严禁用于人体和临床。
4. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
5. 部分产品我司仅提供部分信息，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]. Li Y, et al. Erastin induces ferroptosis via ferroportin-mediated iron accumulation in endometriosis. Hum Reprod. 2021 Mar 18;36(4):951-964.
- [2]. Huo H, et al. Erastin Disrupts Mitochondrial Permeability Transition Pore (mPTP) and Induces Apoptotic Death of Colorectal Cancer Cells. PLoS One. 2016 May 12;11(5):e0154605.
- [3]. Xie Y, et al. Ferroptosis: process and function. Cell Death Differ. 2016 Mar;23(3):369-79.
- [4]. Gai C, et al. MT1DP loaded by folate-modified liposomes sensitizes erastin-induced ferroptosis via regulating miR-365a-3p/NRF2 axis in non-small cell lung cancer cells. Cell Death Dis. 2020 Sep 14;11(9):751.
- [5]. Yang Y, et al. Piperlongumine Inhibits Thioredoxin Reductase 1 by Targeting Selenocysteine Residues and Sensitizes Cancer Cells to Erastin. Antioxidants (Basel). 2022 Apr 4;11(4):710.
- [6]. Liu N, et al., Activation of the reverse transsulfuration pathway through NRF2/CBS confers erastin-induced ferroptosis resistance. Br J Cancer. 2020 Jan;122(2):279-292.
- [7]. Chen T, et al., Mitochondrial transplantation rescues neuronal cells from ferroptosis. Free Radic Biol Med. 2023 Nov 1;208:62-72.
- [8]. Zhu JF, et al., Ibrutinib facilitates the sensitivity of colorectal cancer cells to ferroptosis through BTK/NRF2 pathway. Cell Death Dis. 2023 Feb 23;14(2):151.
- [9]. Doll S, et al., FSP1 is a glutathione-independent ferroptosis suppressor. Nature. 2019 Nov;575(7784):693-698.
- [10]. Li P, et al., Inhibition of cannabinoid receptor type 1 sensitizes triple-negative breast cancer cells to ferroptosis via regulating fatty acid metabolism. Cell Death Dis. 2022 Sep 21;13(9):808.
- [11]. Dixon SJ, et al. Pharmacological inhibition of cystine-glutamate exchange induces endoplasmic reticulum stress and ferroptosis. Elife. 2014 May 20;3:e02523.
- [12]. Xu X, et al. Targeting SLC7A11 specifically suppresses the progression of colorectal cancer stem cells via inducing ferroptosis. Eur J Pharm Sci. 2020 Sep 1;152:105450.