



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Imidazole ketone erastin (Synonyms: IKE)**

CAS 号: **1801530-11-9**

产品货号: **S88500**

生物活性:

Description	Imidazole ketone erastin 是一种有效的, 选择性的, 代谢稳定的胱氨酸-谷氨酸逆转运蛋白, system xc- 抑制剂和 ferroptosis 活化剂。Imidazole ketone erastin 具有抗肿瘤活性。			
IC50 & Target	System Xc-, ferroptosis[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CCF-STTG1	IC ₅₀	30 nM	Inhibition of Xct in human CCF-STTG1 cells assessed as glutamate release after 2 hrs by fluorometry
	DOHH-2	IC ₅₀	0.014 μM	Anticancer activity against human DOHH-2 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
	HT-1080	GI ₅₀	314 nM	Growth inhibition of human HT1080 cells after 48 hrs by alamar blue assay
	SU-DHL-16	IC ₅₀	0.012 μM	Anticancer activity against human SU-DHL-16 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
	SU-DHL-2	IC ₅₀	0.021 μM	Anticancer activity against human SUDHL2 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
	SU-DHL-5	IC ₅₀	0.001 μM	Anticancer activity against human SU-DHL-5 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
	SU-DHL-6	IC ₅₀	0.001 μM	Anticancer activity against human SU-DHL-6 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
	SU-DHL10	IC ₅₀	0.004 μM	Anticancer activity against human SU-DHL-10 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 24 hrs by CellTiter-Glo luminescent assay
In Vitro	Imidazole ketone erastin (IKE) (0.1 nM-100 μM; 24 小时) 通过脂质过氧化和铁死亡有效减少弥漫性大 B 细胞淋巴瘤 (DLBCL) 细胞数量[1]。 IKE (1-250 nM; 24 小时) 以剂量依赖性方式消耗还原谷胱甘肽 (GSH), 在 SUDHL6 细胞中的 IC50 为 34 nM[1]。 IKE (125-500 nM) 以剂量依赖性方式增加 SUDHL-6 细胞中的脂质 ROS[1]。 IKE (500 nM; 5-360 分钟) 增加系统 xc 组分 SLC7A11, 前列腺素-内过氧化物合酶 2 (PTGS2) 和 ChaC 谷胱甘肽特异性 γ-谷氨酰环化转移酶 1 (CHAC1) 在 SUDHL-6 细胞中的表达[1]。 IKE (500 nM 和 1 μM) 改变了 SUDHL6 细胞中 62 种脂质种类的相对丰度, 包括溶血磷脂酰胆碱 (LPC)、磷脂酰胆碱 (PC)、磷脂酰乙醇胺 (PE) 和甘油三酯 (TAG)[1]。 IKE (500 nM) 激活 SUDHL6 细胞中的从头脂质生物合成途径、磷脂重塑途径和花生四烯酸氧化途径[1]。			
In Vivo	IKE (23-40 mg/kg; 腹腔注射, 每日一次, 连续 13 天) 可抑制小鼠肿瘤生长[1]。 IKE (50 mg/kg; 单次腹腔注射) 从 4 小时开始显著消耗 GSH, 并增加小鼠体内游离脂肪酸、			



	磷脂和二酰甘油 (DAG) 的相对丰度[1]。 IKE（50 mg/kg）在小鼠体内以不同方式给药（分别为腹腔注射、静脉注射和口服）后，其半衰期（1.82、1.31 和 0.96 h）和 C_{max}（19515、11384 和 5203 ng/mL）[1]。 <table><tr><td>Animal Model:</td><td>Male NCG mice bearing SUDHL6 subcutaneous xenografts[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>23, 40 mg/kg</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>I.p. injection once daily for 13 days</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Caused a significant decrease in tumor growth starting from day 9. Had a weight loss starting from day 9.</td></tr><tr><td>Animal Model:</td><td>NOD/SCID mice (12 weeks old; ~28 g weight)[1]</td></tr><tr><td>Dosage:</td><td>50 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)</td></tr><tr><td>Administration:</td><td>A single i.p., i.v., and p.o. administration</td></tr><tr><td>Result:</td><td>I.p.: T_{1/2}=1.82 h, C_{max}=19515 ng/mL. I.v.: T_{1/2}=1.31 h, C_{max}=11384 ng/mL. P.o.: T_{1/2}=0.96 h, C_{max}=5203 ng/mL.</td></tr></table>	Animal Model:	Male NCG mice bearing SUDHL6 subcutaneous xenografts[1]	Dosage:	23, 40 mg/kg	Administration:	I.p. injection once daily for 13 days	Result:	Caused a significant decrease in tumor growth starting from day 9. Had a weight loss starting from day 9.	Animal Model:	NOD/SCID mice (12 weeks old; ~28 g weight)[1]	Dosage:	50 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)	Administration:	A single i.p., i.v., and p.o. administration	Result:	I.p.: T _{1/2} =1.82 h, C _{max} =19515 ng/mL. I.v.: T _{1/2} =1.31 h, C _{max} =11384 ng/mL. P.o.: T _{1/2} =0.96 h, C _{max} =5203 ng/mL.	
Animal Model:	Male NCG mice bearing SUDHL6 subcutaneous xenografts[1]																	
Dosage:	23, 40 mg/kg																	
Administration:	I.p. injection once daily for 13 days																	
Result:	Caused a significant decrease in tumor growth starting from day 9. Had a weight loss starting from day 9.																	
Animal Model:	NOD/SCID mice (12 weeks old; ~28 g weight)[1]																	
Dosage:	50 mg/kg (Pharmacokinetic Analysis)																	
Administration:	A single i.p., i.v., and p.o. administration																	
Result:	I.p.: T _{1/2} =1.82 h, C _{max} =19515 ng/mL. I.v.: T _{1/2} =1.31 h, C _{max} =11384 ng/mL. P.o.: T _{1/2} =0.96 h, C _{max} =5203 ng/mL.																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度：100 mg/mL (152.64 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) <table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td>Solvent \ Mass Concentration</td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>1.5264 mL</td><td>7.6320 mL</td><td>15.2639 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.3053 mL</td><td>1.5264 mL</td><td>3.0528 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.1526 mL</td><td>0.7632 mL</td><td>1.5264 mL</td></tr></table> *请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80°C, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80°C 储存时，请在 6 个月内使用，-20°C 储存时，请在 1 个月内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。	Preparing Stock Solutions	Solvent \ Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	1.5264 mL	7.6320 mL	15.2639 mL	5 mM	0.3053 mL	1.5264 mL	3.0528 mL	10 mM	0.1526 mL	0.7632 mL	1.5264 mL
Preparing Stock Solutions	Solvent \ Mass Concentration		1 mg	5 mg	10 mg													
	1 mM		1.5264 mL	7.6320 mL	15.2639 mL													
	5 mM		0.3053 mL	1.5264 mL	3.0528 mL													
	10 mM	0.1526 mL	0.7632 mL	1.5264 mL														



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (3.82 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Zhang Y, et al. Imidazole Ketone Erastin Induces Ferroptosis and Slows Tumor Growth in a Mouse Lymphoma Model. Cell Chem Biol. 2019 Jan 31. pii: S2451-9456(19)30030-3.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture and light)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.5264 mL	7.6320 mL	15.2639 mL	38.1598 mL
	5 mM	0.3053 mL	1.5264 mL	3.0528 mL	7.6320 mL
	10 mM	0.1526 mL	0.7632 mL	1.5264 mL	3.8160 mL
	15 mM	0.1018 mL	0.5088 mL	1.0176 mL	2.5440 mL
	20 mM	0.0763 mL	0.3816 mL	0.7632 mL	1.9080 mL
	25 mM	0.0611 mL	0.3053 mL	0.6106 mL	1.5264 mL
	30 mM	0.0509 mL	0.2544 mL	0.5088 mL	1.2720 mL
	40 mM	0.0382 mL	0.1908 mL	0.3816 mL	0.9540 mL
	50 mM	0.0305 mL	0.1526 mL	0.3053 mL	0.7632 mL
	60 mM	0.0254 mL	0.1272 mL	0.2544 mL	0.6360 mL
	80 mM	0.0191 mL	0.0954 mL	0.1908 mL	0.4770 mL
	100 mM	0.0153 mL	0.0763 mL	0.1526 mL	0.3816 mL