



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: DTHIB
CAS 号: 897326-30-6
产品货号: S89174

生物活性:					
Description	DTHIB 是一种直接和选择性的 heat shock factor 1 (HSF1) 抑制剂, DTHIB 与 HSF1 DNA 结合域结合的 Kd 为 160 nM。DTHIB 抑制 HSF1 癌症基因标记 (HSF1 CaSig), 并选择性刺激核 HSF1 的降解。DTHIB 具有有效的抗癌活性, 可用于前列腺癌的研究。				
IC50 & Target	Kd: 160 nM (DTHIB binding to the HSF1 DNA binding domain)[1]				
In Vitro	DTHIB (5 μM; 48 h) 处理 C4-2 细胞可诱导细胞周期阻滞, 并导致 G1 期积累。DTHIB 促进前列腺癌 (PCa) 细胞进入衰老状态[1]。				
	DTHIB (0.5-5 μM; 48 h; C4-2 前列腺癌) 处理降低了 C4-2 细胞中分子伴侣 P23、HSP27、HSP70 和 HSP90 的稳态蛋白丰度[1]。				
	DTHIB 以剂量依赖的方式分别减少 C4-2 和 PC-3 前列腺癌细胞的克隆扩增, EC50 值分别为 1.2 μM 和 3.0 μM[1]。				
	在小鼠胚胎成纤维细胞 (MEFs) 中, DTHIB (0.5-10 μM) 以剂量依赖的方式减弱了 HSP70 和 HSP25 分子伴侣在急性热休克下的强烈诱导作用。DTHIB 通过降低多种分子伴侣的稳态转录水平来削弱热休克反应[1]。				
	Cell Cycle Analysis[1]				
	Cell Line:	C4-2 cells			
	Concentration:	5 μM			
	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	Induced cell cycle arrest.			
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:	C4-2 prostate cancer (PCa) cells			
	Concentration:	0.5 μM, 1 μM, 2.5 μM, 5 μM			
	Incubation Time:	48 hours			
	Result:	Dose-dependently inhibited expression of molecular chaperones in C4-2 PCa cells.			
In Vivo	DTHIB (5 mg/kg; 腹腔注射; 每日一次, 持续 3 周) 显著减弱了 C4-2 异种移植小鼠模型中的肿瘤进展[1]。				
	Animal Model:	Nude mice (6 weeks of age) injected with C4-2 cells[1]			
	Dosage:	5 mg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; daily; for 3 weeks			
	Result:	Showed no visible tumor growth over a 3-week period and a 40% reduction in median tumor volume.			
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (322.91 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	3.2291 mL	16.1457 mL	32.2914 mL
		5 mM	0.6458 mL	3.2291 mL	6.4583 mL
10 mM		0.3229 mL	1.6146 mL	3.2291 mL	



	*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, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.08 mg/mL (6.72 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。
参考文献	[1]. Bushu Dong, et al. Targeting therapy-resistant prostate cancer via a direct inhibitor of the human heat shock transcription factor 1. Sci Transl Med. 2020 Dec 16;12(574):eabb5647.

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, 2 years; -20° C, 1 year。-80° C 储存时, 请在 2 年内使用, -20° C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.2291 mL	16.1457 mL	32.2914 mL	80.7285 mL
	5 mM	0.6458 mL	3.2291 mL	6.4583 mL	16.1457 mL
	10 mM	0.3229 mL	1.6146 mL	3.2291 mL	8.0728 mL
	15 mM	0.2153 mL	1.0764 mL	2.1528 mL	5.3819 mL
	20 mM	0.1615 mL	0.8073 mL	1.6146 mL	4.0364 mL
	25 mM	0.1292 mL	0.6458 mL	1.2917 mL	3.2291 mL
	30 mM	0.1076 mL	0.5382 mL	1.0764 mL	2.6909 mL
	40 mM	0.0807 mL	0.4036 mL	0.8073 mL	2.0182 mL
	50 mM	0.0646 mL	0.3229 mL	0.6458 mL	1.6146 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

	60 mM	0.0538 mL	0.2691 mL	0.5382 mL	1.3455 mL
	80 mM	0.0404 mL	0.2018 mL	0.4036 mL	1.0091 mL
	100 mM	0.0323 mL	0.1615 mL	0.3229 mL	0.8073 mL



源叶