

WT161

产品信息

产品名称	产品编号	规格
WT161	54009ES08	5 mg
	54009ES25	25 mg

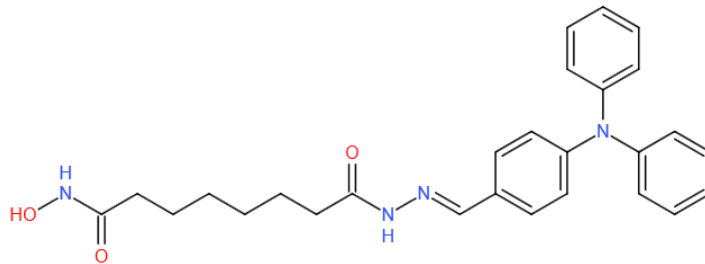
产品描述

WT161 是一种选择性和可逆的 HDAC6 抑制剂(组蛋白去乙酰化酶 6 抑制剂),可抑制 MM 细胞生长,对 HDAC6、HDAC1 的 IC₅₀ 分别为 0.4 nM 和 8.35 nM。WT161 可以介导聚集体蛋白降解,并可能成为联合治疗以克服耐药性的潜在靶标。无论是单独使用还是与蛋白酶体抑制剂联合使用,WT161 显示出显著的抗多发性骨髓瘤 (MM) 在临床前和临床研究中的活性。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	WT-161; WT 161
靶点 (Target)	HDAC6; HDAC1; HDAC2
通路 (Pathway)	Cell Cycle/DNA Damage—HDAC
CAS 号 (CAS NO.)	1206731-57-8
分子式 (Formula)	C ₂₇ H ₃₀ N ₄ O ₃
分子量 (Molecular Weight)	458.55
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥95%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-25~-15℃,保持干燥,有效期3年。建议分装后-20℃干燥保存,避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康,请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心,以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途,禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献,并根据自身实验条件(如实验目的,细胞种类,培养特性等)进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

WT161 与 BTZ 联合引发多泛素蛋白和细胞应激的显著积累，随后是半胱天冬酶活化和细胞凋亡。WT161 增强 BTZ 诱导的 ER 应激和凋亡细胞死亡。WT161 是一种选择性和可逆的 HDAC6 抑制剂，可抑制 MM 细胞生长，在 MM 细胞系中的体外活性为 $IC_{50}=1.5-4.7 \mu M$ 。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

WT161（50-100 mg/kg，腹腔给药）在小鼠体内有合理的半衰期(1.4 h)和药物暴露[最大浓度(C.max)=18 mg/L]。WT161 在 100 mg/kg 时的显示出毒性，但含量为 50 mg/kg 时，WT161 作为单一药物并与 BTZ 联合使用具有良好的耐受性。接下来，我们在人类 MM (MM.161S)的小鼠异种移植模型中测试了 WT1 与 BTZ 的组合。将小鼠随机分为四个治疗组：对照组、BTZ、WT161 和 BTZ + WT161。尽管对照组与 BTZ 治疗或 WT161 治疗等几个治疗组之间的肿瘤生长没有显著差异，但 BTZ 联合 WT161 治疗组展示出显著的抗肿瘤作用。^[1]

参考文献

[1] Hideshima T, et al. Discovery of selective small-molecule HDAC6 inhibitor for overcoming proteasome inhibitor resistance in multiple myeloma. Proc Natl Acad Sci U S A. 2016 Nov 15;113(46):13162-13167. doi: 10.1073/pnas.1608067113. Epub 2016 Oct 31. PMID: 27799547; PMCID: PMC5135369.