

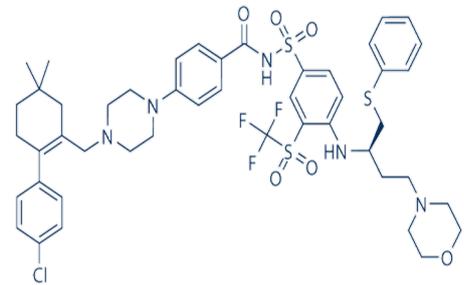
ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0011-10mM	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0011-5mg	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2 抑制剂)	5mg
SC0011-25mg	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	4-[4-[[2-(4-chlorophenyl)-5,5-dimethylcyclohexen-1-yl]methyl]piperazin-1-yl]-N-[4-[[[(2R)-4-morpholin-4-yl-1-phenylsulfanylbutan-2-yl]amino]-3-(trifluoromethylsulfonyl)phenyl]sulfonyl]benzamide
简称	ABT-263
别名	Navitoclax, ABT263, ABT 263, A-855071
中文名	N/A
化学式	C ₄₇ H ₅₅ ClF ₃ N ₅ O ₆ S ₃
分子量	974.61
CAS号	923564-51-6
纯度	98.9%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.51ml DMSO, 或者每9.75mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0011-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	ABT-263(Navitoclax)是一种有效的Bcl-xL、Bcl-2和Bcl-w抑制剂, 无细胞试验中Ki分别为≤0.5nM、≤1nM和≤1nM, 但与Mcl-1和A1结合微弱。Phase 2。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	Bcl-xL	Bcl-2	Bcl-w	A1	Mcl-1
IC50	<=0.5nM(Ki)	<=1nM(Ki)	<=1nM(Ki)	354nM(Ki)	550nM(Ki)
体外研究	ABT-263有效抑制Bcl-2蛋白家族, 用荧光偏振分析法测试ABT-263作用于Bcl-xL、Bcl-2和Bcl-w时, Ki分别为0.5、1和1nM。ABT-263结构上与ABT-737相关。ABT-263阻断Bcl-2和Bcl-XL与凋亡前体蛋白相互作用。Bcl-2家族成员Bcl-2、Bcl-XL和Mcl-1的过量表达通常都与肿瘤的修复及抗药性有关。ABT-263作用于过量表达的Bcl-2和Bcl-XL时显示出保护作用, EC50分别为60和20nM。ABT-263作用于不同的细胞显示出不同的细胞活性, 作用于H146细胞系时EC50为110nM, 而作用于H82细胞系时EC50为22μM。ABT-737可以有效作用于四种EC50值<400nM的细胞系, 即H146、H889、H1963和H1417。而两种抗ABT-737的细胞系, 即H1048和H82, 同样也显示出抗ABT-263的特性。				
体内研究	用ABT-263处理H345移植瘤模型, 按动物体重, 每千克每天处理10mg ABT-263, 结果肿瘤生长抑制率达80%, 肿瘤体积减小了50%以上, 显示出ABT-263极强的抗癌效果。ABT-263作用于非小细胞肺癌和急性淋巴细胞白血病的移植瘤模型时, 每天单独口服, 结果显示肿瘤完全消退。ABT-263单独作用于B-细胞淋巴瘤和多发性骨髓瘤的移植瘤模型时效果不明显, 但是可以显著增强临床其他相关用药的药性。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	用竞争性荧光偏振检测测定ABT-263作用于Bcl-2家族不同亚型的Ki值或者IC50值。使用如下的肽探针或者蛋白对: f-bad(1nM)和Bcl-xL(6nM)、f-Bax(1nM)和Bcl-2(10nM)、f-Bax(1nM)和Bcl-w(40nM)、f-Noxa(2nM)和Mcl-1(40nM)、f-Bax(1nM)和Bcl-2-A1(15nM)。用时间分辨荧光共振能量转移法测定ABT-263和Bcl-xL作用的结合紧密度。1nM用His标记的Bcl-xL与200nM f-Bak及1nM Tb标记的His抗体混合, 然后在室温下处理30分钟。

细胞实验	
细胞系	SCLC细胞系
浓度	0-1 μ M
处理时间	48小时
方法	人类肿瘤细胞系在37°C含5% CO ₂ 环境下获得，SCLC细胞系培养在RPMI 1640培养基中，培养基包含10%胎牛血清，1%丙酮酸钠，25mM HEPES，4.5g/L葡萄糖，1%青霉素/链霉素。用含有10% FBS和1%青霉素/链霉素的RPMI 1640培养基培养白血病和淋巴瘤细胞系。细胞在96孔板上处理48小时，最终体积达到100 μ l。在体外测试ABT-263的细胞毒性。

动物实验	
动物模型	C.B.-17严重联合免疫缺陷-米黄鼠
配制	ABT-263在10%乙醇、30%聚乙二醇400及60% Phosal 50 PG中制成
剂量	100mg/kg/d
给药方式	口服处理

➤ 参考文献:

1. Tse C, et al. Cancer Res. 2008; 68(9):3421-3428.
2. Shoemaker AR, et al. Clin Cancer Res.2008; 14(11):3268-3277.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0011-10mM	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0011-5mg	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2抑制剂)	5mg
SC0011-25mg	ABT-263 (Navitoclax) (Bcl-2抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2016.12.12