

**康普瑞汀磷酸二钠盐；**
**Combretastatin A4 disodium phosphate (CA4P) ; Fosbretabulin disodium**

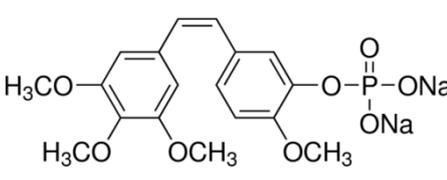
产品编号：MB1223

质量标准：&gt;98%

包装规格：10MG；50MG

产品形式：白色至米色粉末

**基本信息**

分子式	C18H19O8P2Na	结 构 式	
分子量	440.29		
CAS No.	168555-66-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	Water 28 mg/mL (63.59 mM) DMSO Insoluble Ethanol Insoluble		
注意事项	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。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介：** Fosbretabulin(CA 4DP; CA 4P)二钠是微管去稳定剂，能靶向损伤血管。

**物理性状及指标：**

外观：.....白色至米色粉末

熔点：.....238-242 °C

溶解性：.....Water 28 mg/mL (63.59 mM)；DMSO Insoluble；Ethanol Insoluble

纯度：.....&gt;98%

**生物活性**

<b>产品描述</b>	康普瑞汀磷酸二钠盐是水溶性的 Combretastatin A4 (CA4)前药，CA4 靶向作用于微管从而与 $\beta$ -微管蛋白结合，无细胞试验中 $K_d$ 为 0.4 $\mu$ M。Fosbretabulin Disodium 抑制微管蛋白聚合， <b>IC50</b> 为 2.4 $\mu$ M，也会干扰肿瘤血管。Phase 3。
<b>特性</b>	相关的微管抑制剂与高亲和力 $\beta$ -tubulin 与秋水仙碱。最佳治疗晚期实体肿瘤、甲状腺癌、脉络膜新生血管。
<b>靶点</b>	Tubulin (Cell-free assay) 2.4 $\mu$ M
<b>体外研究</b>	Fosbretabulin disodium (Combretastatin A-4 phosphate disodium, CA4P disodium)是 Combretastatin A4 (CA4)的水溶性前体药物，靶向作用于微管，最初是从非洲树 Combretum caffrum 中分离得到的。CA4 是微管蛋白结合剂，结合或靠近到 $\beta$ -微管蛋白的秋水仙素结合位点 ( $K_d$ = 0.40 $\mu$ M)，抑制微管蛋白装配， <b>IC50</b> 为 2.4 $\mu$ M。CA4 对增殖的内皮细胞而非休眠的内皮细

	胞具有细胞毒性，对肿瘤血管具有强效的，选择性的毒性。CA4P ( 1 mM, 30 分钟 ) 破坏内皮细胞微管骨架，并介导内皮细胞的形态变化。CA4P 刺激肌动蛋白应力纤维的形成和膜出泡，且通过 Rho/ Rho 激酶提高单层通透性。CA4P 提高内皮细胞通透性，主要通过干 VE-cadherin/ $\beta$ -catenin/Akt 信号通路，而抑制内皮细胞迁移和毛细管形成，从而导致快速的血管性虚脱和肿瘤坏死
<b>体内研究</b>	CA4P 按 10% 的最大耐受剂量 ( MTD ) 单独给药处理实验性肿瘤模型，导致快速的，广泛的，不可逆的血管关闭。CA4P 处理 6 小时后，血管容积下降 93%。CA4P 按 100 mg/kg 剂量处理 6 小时后，肿瘤血降低约 100 倍，脾中降低约 7 倍。

**用途及描述：**科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。Fosbretabulin 二钠 (combreatin A4 磷酸盐, CA4P) 是一种强有力的血管破坏剂(VDA)。作用原理是其在血管内皮细胞里，在血管内与管状蛋白二聚体结合，阻止微管聚合，导致内皮细胞有丝分裂的抑制和凋亡。Fosbretabulin 二钠是一种有效的抗癌药物，对肿瘤血管有抗血管作用，诱导肿瘤血流迅速减少，并伴随细胞坏死增加。它的一些活动包括干扰血管内皮-cadherin 信号，以及它的微管干扰活动。

#### 储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2712 mL	11.3562 mL	22.7123 mL
5 mM	0.4542 mL	2.2712 mL	4.5425 mL
10 mM	0.2271 mL	1.1356 mL	2.2712 mL
50 mM	0.0454 mL	0.2271 mL	0.4542 mL

#### 经典实验操作 ( 仅供参考 )

<b>激酶实验</b>	<b>微管蛋白装配-拆卸:</b> 从微管分离的微管蛋白的组装在 350nm 下通过分光光度法进行，且利用浊度增加，这是与微管形成相关。温度从 10°C 提升到 35°C 组装开始。药物促进光吸收。药物溶解于 DMSO (<4%)，从而不影响对照组。
<b>细胞实验</b>	<b>Cell lines:</b> HUVECs <b>Concentrations:</b> ~50 nM <b>Incubation Time:</b> 12-48 小时 <b>Method:</b> 增殖实验中，FBS 在 X-VIVO 培养基中稀释到最低浓度 ( 1% )，以便使内皮细胞有足够的生存能力。分离后，细胞按 $2 \times 10^4$ HUVECs 浓度接种到 24 孔板中，粘附过夜，在有或无细胞因子 (5 ng/ml FGF-2 或 5 ng/ml VEGF-A) 的情况下继续培养。添加 0-50 nMCA4P。温育 12, 24, 36, 和 48 小时后，使用胰蛋白酶/ EDTA 分离细胞，通过台酚蓝染色排除法进行手工计数。
<b>动物实验</b>	<b>Animal Models:</b> 含移植瘤的 BD9 大鼠 <b>Formulation:</b> 含有几滴 5% $\text{Na}_2\text{CO}_3$ 的 0.9% 的生理盐水 <b>Dosages:</b> 100 mg/kg, 3 ml/kg

	<b>Administration:</b> 腹腔注射
--	-----------------------------

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸

湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。