

Tamibarotene ; 他米巴罗汀

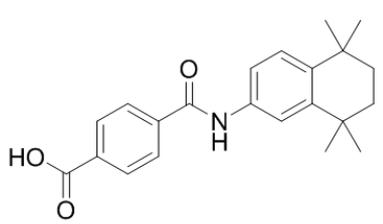
产品编号：MB1802

质量标准：≥99.0%,BR

包装规格：10MG；50MG

产品形式：白色至类白色粉末

基本信息

分子式	C ₂₂ H ₂₅ NO ₃	结 构 式	
分子量	351.44		
CAS No.	94497-51-5		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 70 mg/mL (199.18 mM) Ethanol 70 mg/mL (199.18 mM) Water 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：他米巴罗汀 Tamibarotene 是 **RAR α / β** 激动剂，化学名为 4-[(5,6,7,8-四-5,5,8,8-四甲基-2-萘基)氨基]苯甲酸，属维甲酸类化合物，具有独特的作用机制和药理特性，可通过解除 PML-RAR α 融合基因的变异性质，恢复早幼粒细胞性白血病细胞及 RAR α 的正常功能，对复发性难治性的急性早幼粒细胞白血病具有显著分化诱导能力从而产生治疗作用。它作为一种新型维甲酸激动剂，具有良好的生物活性，可以抗光、热、氧化反应从而保持性质稳定。它能够调控自身免疫性疾病中免疫细胞，在蛋白和转录水平中均抑制炎症细胞因子的产生。常用于癌症治疗。

别名：Benzoic acid, 4-[[[5,6,7,8-tetrahydro-5,5,8,8-tetramethyl-2-naphthalenyl)amino]carbonyl]

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

MP：.....231-232°C

溶解性：.....DMSO 70 mg/mL (199.18 mM)；Ethanol 70 mg/mL (199.18 mM)；Water Insoluble

纯度：.....≥99.0%,BR

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

作用机制及生物活性

- 本品作为一种诱导分化剂，在体外对急性髓细胞白血病细胞株及急性早幼粒细胞白血病细胞株的诱导效应是全反式维甲酸类药物的十几倍。本品可选择性结合 RAR α 与 RAR β ，影响 PML/RAR 融合基因及融合蛋白的生成达到抑制发病的目的，而与主要分布在皮肤组织的 RAR γ 结合力小，减少了天然维甲酸类中出现的不良反应。几乎不与 CRABP 结合，在血浆中可达稳定的药物浓度，故不易产生耐药。这在抗肿瘤科研中是一个优势。
- 本品作用于血液系统肿瘤细胞株时可抑制多种血液系统肿瘤细胞生长。本品能够使细胞生长调节因子分泌显著升高，引起细胞向中性粒细胞分化。
- 本品能够抑制平滑肌细胞的增殖。本品作用于平滑肌细胞后可抑制血管损伤后新内膜形成的转录调节因子的脱磷酸作用，同时可增强平滑肌细胞分化标志相关基因的表达，促进平滑肌细胞的分化，降低血管支架植入后的再次狭窄的发生风险，从而能够抑制平滑肌细胞的增殖。而同样浓度或更高浓度的全反式维甲酸类却无类似

作用效应。

产品描述	Tamibarotene 是特异性的 RAR-alpha/beta 激动剂, 用于治疗全反式视黄酸耐受的急性白血病。	
靶点	RAR α	RAR β
体外研究	Tamibarotene 略微抑制了骨髓瘤细胞和内皮细胞的生长, 并显著抑制通过血管内皮生长因子刺激的内皮细胞的生长。Tamibarotene 对骨髓基质细胞 (BMSCs) 有小的生长抑制, 但显著抑制通过共培养的骨髓瘤细胞抑制内皮细胞的迁移。Tamibarotene 抑制 VEGF 诱导的血管内皮生长因子受体的磷酸化。在小鼠角膜中, VEGF 显著抑制 VEGF 诱导的体外管样结构的形成和新生血管的形成。Tamibarotene 诱导的 HL-60 细胞粘附到内皮细胞比全反式维甲酸 (ATRA) 低 38% , Tamibarotene 诱导 NB4 细胞粘附到内皮细胞的能力和 ATRA 相当, 它诱导 HL-60 细胞的 CD38 基因的转录, 通过含有内含子 1 的 DR-RARE 诱导早期基因转录, 通过 RARE 缺乏 5'-侧翼区诱导晚期基因表达。Tamibarotene 诱导 HL-60 细胞中的早期基因表达, 导致比 ATRA 低的 CD38 诱导。Tamibarotene 具有可忽略的对外周血单核细胞的生长抑制, 但对 HTLV-I 感染 T 细胞系和 ATL 细胞的标记的生长抑制很强。在 HTLV-I 感染 T 细胞系中, Tamibarotene 使细胞停留在细胞周期的 G1 期, 并诱导细胞凋亡。Tamibarotene 也抑制 IkappaBalpha 的磷酸化和 NF- κ B-DNA 结合, 并减少参与 G1/S 期细胞周期的过渡和凋亡蛋白表达。Tamibarotene 也抑制 JunD 的表达, 从而抑制 AP-1 的 DNA 结合。	
体内研究	Tamibarotene 治疗显著降低小鼠的脑中不溶的 A β 水平, 特别的 A β (42), 而它对可溶的 A β 水平的没有明显效果。	

美仑相关产品推荐

MB4300	TTNPB (Arotinoid Acid)
MB4505	740Y-P
MB3878	AS-252424
MB3883	AZD6482
CL-11196	BAG956
MB3434	CH5132799
MB3885	CUDC-907
MB3870	GDC-0980 (RG7422)
MB3891	GSK1059615
MB5322	PF-4989216
MB3864	PI-103
CL-10040	TG100713
MB5302	VS-5584
MB5319	XL-147

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。Tamibarotene 是 RAR α/β 激动剂。用于治疗全反式视黄酸耐受的急性白血病等相关科研领域研究。

储液配置

体 积 浓度	质 量	1 mg	5 mg	10 mg

1 mM	2.8454 mL	14.2272 mL	28.4544 mL
5 mM	0.5691 mL	2.8454 mL	5.6909 mL
10 mM	0.2845 mL	1.4227 mL	2.8454 mL
50 mM	0.0569 mL	0.2845 mL	0.5691 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验	<p>CytTurter 水性非放射性细胞增殖测定试剂盒用于评估细胞生长。</p> <p>每孔 10000 个细胞接种在 96 孔板中,并在含有 2% 个木炭剥离的 FBS 的 RPMI 中培养,并在 72 小时内显示维甲酸浓度。在治疗结束时,加入 MTS 试剂,细胞再培养 2-4 小时,在 490 纳米处测量吸光度。</p>
动物实验	<p>Tamibarotene (2.5 毫克/千克) 悬浮在 0.5% 羧甲基纤维素溶液中。</p> <p>感染时,给予小鼠口服悬浮液中的磺胺甲恶唑和甲氧苄啶 10 毫升去离子水随意 10 天,以减少天然菌群并支持牙龈卟啉单胞菌 W83 的定植。抗生素治疗结束后 4 天,通过口服接种法建立牙周感染,其中使用 1010 微克菌落形成单位的悬浮于 100μL 4% 羧甲基纤维素 (CMC) 中的牙龈卟啉单胞菌 7 天。在第一次口服接种后 4 周使小鼠安乐死。Tamibarotene (2.5mg / kg) 悬浮于 0.5% 羧甲基纤维素溶液中。药物每天以 0.1mL / 10g 体重的体积经口灌胃入食管。在诱导牙周炎前 1 小时施用 Tamibarotene,然后按照方案每日施用直至第 28 天。具有牙周病的对照小鼠接受相同体积的 0.5% 羧甲基纤维素溶液。每 3 天测量每只小鼠的体重。</p>

【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。