

### CBL0137 (CBL-0137)

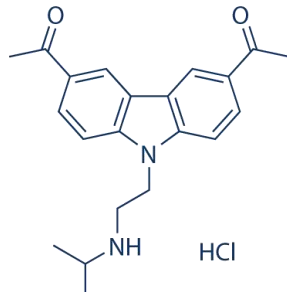
产品编号: MB2624

质量标准: >98%,BR

包装规格: 2mg/10mg

产品形式: solid

#### 基本信息

分子式	C <sub>21</sub> H <sub>24</sub> N <sub>2</sub> O <sub>2</sub> .HCl	结构式	
分子量	372.89		
CAS No.	1197397-89-9		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H <sub>2</sub> O : 24 mg/mL (64.36 mM) DMSO: 38 mg/mL (101.91 mM) 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:** CBL0137(CBL-0137)激活 p53 并抑制 NF-κB, 在细胞实验中, IC<sub>50</sub> 分别为 0.37 μM 和 0.47 μM。它还能抑制组蛋白分子伴侣 FACT, FACT 促进染色质转录复合体的形成。

#### 物理性状及指标:

外观: .....粉末

溶解性: .....H<sub>2</sub>O : 24 mg/mL (64.36 mM); Ethanol: Insoluble ; DMSO: 38 mg/mL (101.91 mM)

含量: .....>98%

**储存温度:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

#### 生物活性

<b>描述</b>	CBL0137(CBL-0137)激活 p53 并抑制 NF-κB, 在细胞实验中, IC <sub>50</sub> 分别为 0.37 μM 和 0.47 μM。它还能抑制组蛋白分子伴侣 FACT, FACT 促进染色质转录复合体的形成。	
<b>IC<sub>50</sub> &amp; Target</b>	p53 (Cell-free assay)	NF-κB (Cell-free assay)
	0.37 μM(EC <sub>50</sub> )	0.47 μM(EC <sub>50</sub> )
<b>体外</b>	在胰腺癌细胞系中, CBL0137 是有效的凋亡诱导剂, 不仅对增殖中的大部分肿瘤细胞具有细胞毒性, 同样也对胰腺癌干细胞有毒害作用。CBL0137 和相关的分子可同时激活 p53、抑制 NF-κB 和 HSF-1 介导的细胞应激通路。CBL0137 与 DNA 结合, 但并不引起任何类型的 DNA 化学修饰, 因而不具有基因毒性。然而, CBL0137 与 DNA 结合会造成 Facilitates Chromatin Transcription (FACT)复合体的功能性失活 (FACT 参与转录、复制和 DNA 修	

	复)。经 CBL0137 处理的细胞，核内 FACT 被染色质捕获，从而造成 FACT 依赖性的转录受到抑制。此外，染色质捕获 FACT 还造成了 CK2 依赖性的磷酸化和 p53 的激活。
体内	在小鼠中，CBL0137 对多种胰腺导管腺癌模型具有疗效。CBL0137 靶向恶性胶质瘤，可透过血脑屏障，对 TMZ-responsive 和 resistant 模型都具有活性。因为 CBL0137 可透过血脑屏障，特别是通过静脉注射给药时，因而它具有治疗中枢神经系统肿瘤的潜力。在原位模型中，静脉注射途径比口服途径的生物利用度更高。在正常脑组织中 CBL0137 的积累没有明显的神经毒性。
细胞实验	Cell lines: 肿瘤细胞(HT1080, RCC45, MiaPaca)和正常细胞(Wi38, NKE-hTERT) Concentrations: 2 $\mu$ M Incubation Time: 24 h Method: Effects of CBL0137 (2 $\mu$ M for 24 hours) on cell cycle in tumor (HT1080, RCC45, MiaPaca) and normal cells (Wi38, NKE-hTERT) are examined using FACS analysis of propidium iodide-stained cells. (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: 小鼠移植瘤模型(无胸腺裸鼠) Formulation: 水 Dosages: 30 mg/kg Administration: 口服填喂法 (Only for Reference)

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB2623	Kevetrin HCl
MB0771	Pifithrin- $\mu$
MB4077	NSC 319726

**储液配置及储存:** 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热(在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

浓度	DMSO 质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6818 mL	13.4088 mL	26.8176 mL
5 mM	0.5364 mL	2.6818 mL	5.3635 mL
10 mM	0.2682 mL	1.3409 mL	2.6818 mL
50 mM	0.0536 mL	0.2682 mL	0.5364 mL

【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，请选择合适溶剂，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。