

**ABT737 ; ABT-737**

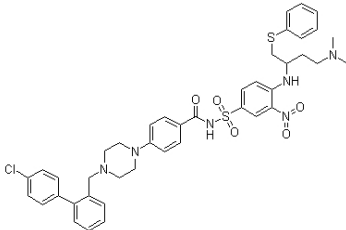
产品编号 : MB3969

质量标准 : &gt;98% , BH3 类抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

**基本信息**

|          |                                                                    |             |                                                                                     |
|----------|--------------------------------------------------------------------|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------|
| 分子式      | C42H45ClN6O5S2                                                     | 结<br>构<br>式 |  |
| 分子量      | 813.43                                                             |             |                                                                                     |
| CAS No.  | 852808-04-9                                                        |             |                                                                                     |
| 储存条件     | -20℃，避光防潮密闭干燥                                                      |             |                                                                                     |
| 溶解性(25℃) | DMSO：100 mg/mL (122.93 mM)<br>Water Insoluble<br>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 :** ABT-737 是一种 BH3 模拟抑制剂, 作用于 Bcl-xL , Bcl-2 和 Bcl-w。**别名 :** ABT 737;4-[4-[[2-(4-chlorophenyl)phenyl]methyl]piperazin-1-yl]-N-[4-[[[(2R)-4-(dimethylamino)-1-phenylsulfanylbutan-2-yl]amino]-3-nitrophenyl] sulfonyl]benzamide**物理性状及指标 :**

外观 : .....淡黄色至黄色固体

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (122.93 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 : .....&gt;98%

**储存条件 :** -20℃ , 避光防潮密闭干燥**生物活性**

|     |                                                                    |
|-----|--------------------------------------------------------------------|
| 品描述 | ABT-737 是一种 BH3 模拟抑制剂, 作用于 Bcl-xL , Bcl-2 和 Bcl-w , 无细胞试验中 EC50 分别 |
|-----|--------------------------------------------------------------------|

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               |                             |                            |                            |
|------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|
|      | 为 78.7 nM , 30.3 nM 和 197.8 nM ; 但对 Mcl-1 , Bcl-B 及 Bfl-1 没有抑制作用。Phase 2。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                     |                             |                            |                            |
| 特性   | ABT-737 是第一代抗凋亡 BCL-2 家族蛋白小分子抑制剂。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                             |                            |                            |
| 靶点   | Bcl-2<br>(Cell-free assay)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | Bcl-xL<br>(Cell-free assay) | Bcl-w<br>(Cell-free assay) | Bcl-B<br>(Cell-free assay) |
|      | 30.3 nM(EC50)                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | 78.7 nM(EC50)               | 197.8 nM(EC50)             | 1.82 μM(EC50)              |
| 体外研究 | <p>ABT-737 降低 BCL-2/BAX 异质二聚体,而诱导 HL60 细胞凋亡,但是对细胞周期分布没有抑制效果。ABT-737 也诱导细胞色素 C 从线粒体中释放,促进 BAX 构象改变, BAX 与凋亡相关。在白血病模型中 ,ABT-737 按 30 mg/kg 处理 ,阻断 53%白血病负荷 ,且使鼠寿命明显延长。ABT-737 不会导致血细胞数和血清组成发生异常。通过使 Mcl-1 失活而使抵抗细胞 (Hela 和 MCF-7 ) 对 ABT-737 敏感。当 Mcl-1 无效时 ,ABT-737 也导致 BAX/BAK-依赖的细胞色素 C 释放。</p> <p>ABT-737 延长携带 BCL-2 肿瘤的鼠寿命。ABT-737 从 BCL2' s BH3 结合袋取代 BIM,使 BIM 激活 BAX,诱导线粒体透化作用,快速致死慢性淋巴细胞性白血病(CLL)细胞。Noxa 正向调节增强 H196 细胞对 ABT-737 敏感性。ABT-737 抑制多种 SCLC 细胞系,包括 NCI-H889, NCI-H1963, NCI-H1417, NCI-H146 等的增殖,并诱导细胞凋亡。最近研究显示,ABT-737 作用于 ATLL 细胞 ,明显诱导 HTLV-1 感染的 T 细胞凋亡。ABT-737 按 100 mg/kg 剂量作用于 ATLL 鼠模型显示出强抗癌活性。</p> |                             |                            |                            |
| 体内研究 | <p>ABT-737 按 30 mg/kg 剂量作用于白血病模型,抑制白血病负担值达 53%, 且明显延长鼠寿命。ABT-737 不会引起血细胞数和血浆化学性质发生变话。 ABT-737 延长移植 BCL-2 传感肿瘤的鼠寿命。ABT-737 按 100 mg/kg 剂量作用于 ATLL 鼠模型具有强抗癌活性。</p>                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                              |                             |                            |                            |

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)

|        |                      |
|--------|----------------------|
| MB4611 | ABT-263 (Navitoclax) |
|--------|----------------------|

**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。ABT-737 是一种 BH3 模拟抑制剂, 作用于 Bcl-xL , Bcl-2 和 Bcl-w 本品可用于相关领域的科研实验。

#### 储液配置

|                 |      |      |       |
|-----------------|------|------|-------|
| 体 质<br>浓 量<br>积 | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
|-----------------|------|------|-------|

|       |           |           |            |
|-------|-----------|-----------|------------|
| 1 mM  | 1.2294 mL | 6.1468 mL | 12.2936 mL |
| 5 mM  | 0.2459 mL | 1.2294 mL | 2.4587 mL  |
| 10 mM | 0.1229 mL | 0.6147 mL | 1.2294 mL  |
| 50 mM | 0.0246 mL | 0.1229 mL | 0.2459 mL  |

**经典实验操作（仅供参考）**

|             |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                       |
|-------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| <b>激酶实验</b> | <p><b>荧光偏振实验:</b></p> <p>测定 GST-BCL-2 蛋白家族与 FITC-BIM BH3 域结合的亲和力。100 nM GST-BCL-2 家族融合蛋白和不同浓度 ABT-737 在 PBS 温育 2 分钟。然后，加入 20 nM FITC-BIM BH3 肽。进行荧光偏振，测定 IC50 值。</p>                                                                                                                                                                                  |
| <b>细胞实验</b> | <p><b>Cell lines:</b> SCLC 细胞系，包括 NCI-H889, NCI-H1963, NCI-H1417, NCI-H146, NCI-187, DMS79, NCI-1048, NCI-H82, NCI-H196, H69AR,和 DMS114</p> <p><b>Concentrations:</b> 0.001-10 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b></p> <p>SCLC 细胞在含 10%人血浆的 100 <math>\mu</math>L 组织培养基的 96 孔培养板上处理 48 小时，使用 MTS 测定存活细胞。</p> |
| <b>动物实验</b> | <p><b>Animal Models:</b> 注射 ER 细胞的 Scid 鼠</p> <p><b>Formulation:</b> 30% 丙二醇, 5% Tween-80, 65% D5W (5% 葡萄糖水溶液) (pH 4-5)</p> <p><b>Dosages:</b> 20 mg/kg 和 30 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> 腹腔注射</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。