HA14-1

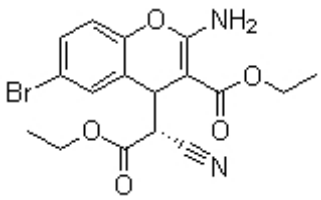
产品编号：MB3970

质量标准：>98%,非肽类 Bcl-2 表面口袋配体

包装规格：10MG;50MG;200MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C17H17BrN2O5	结构式	
分子量	409.23		
CAS No.	65673-63-4		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：82 mg/mL (200.37 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol ： 82 mg/mL (200.37 mM)		
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：HA14-1 是一种 Bcl-2/Bcl-x_L 拮抗剂。HA14-1 与 Bcl-2 上的特定口袋结合, 并抑制 Bcl-2 功能。

别名：Ethyl 2-amino-6-bromo-4-(1-cyano-2-ethoxy-2-oxoethyl)-4H-chromene-3-carboxylate

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO：82 mg/mL (200.37 mM)；Water Insoluble；Ethanol ： 82 mg/mL (200.37 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20℃，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	HA14-1 是 Bcl-2 的非肽配体，IC50 为~9 μM。
靶点	Bcl-2
IC50	9 μM
体外研究	HA14-1 是 Bcl-2 的小分子非肽配体，分子量为 409，IC50 约为 9 μM。HA14-1 通过激活 caspase 而诱导 HL-60 细胞凋亡，这种作用具有剂量依赖性。[HA14-1 作用于滤泡性淋巴瘤细胞系 HF1A3, HF4.9 和 HF28RA，具有细胞毒性，LC50 分别为 4.5 μM, 12.6 μM 和 8.1 μM。HA14-1 通过 caspase 和 ROS 诱导 HF1A3, HF4.9 和 HF28RA 细胞凋亡。
体内研究	HA14-1(400 nM)处理免疫缺陷小鼠，对胶质母细胞瘤的生没有任何重大影响。但是，HA14-1(400 nM)在体内促进 DNA 损伤剂 Etoposide (2.5 mg/Kg) 对胶质母细胞瘤生长的作用效果。

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)

MB7269	ABT-199(GDC-0199)
MB4611	ABT-263 (Navitoclax)
MB7034	奥巴克拉甲磺酸盐

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。HA14-1 是 Bcl-2

的非肽配体，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体积 / 质量 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4436 mL	12.2181 mL	24.4361 mL
5 mM	0.4887 mL	2.4436 mL	4.8872 mL
10 mM	0.2444 mL	1.2218 mL	2.4436 mL
50 mM	0.0489 mL	0.2444 mL	0.4887 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验	**亲和测定:** 根据荧光偏振，通过竞争性结合测定法，测定在体外有机化合物与 Bcl-2 蛋白结合的亲和力。实验中，5-羧基荧光素偶联到肽的 N 末端，GQVGRQLAIIGDDINR 来 Bak 的 BH3 结构域(Flu-BakBH3)，高亲和力结合到 Bcl-xL 蛋白的表面口袋中。根据我们的分子模拟研究和利用荧光偏振进行结合测定，Flu-BakBH3 肽结合到 Bcl-2 的表面口袋具有相似的亲和力。实验中 Bcl-2 作为重组 GST 融合的可溶性蛋白。在标准缓冲液环境下，在有或无有机化合物时，Flu-BakBH3 和 Bcl-2 蛋白混合温育 30 分钟。使用双路径长度石英池(500 µl)，在配备偏振光片的 LS-50 荧光光谱仪上测量 Flu-BakBH3 与 Bcl-2 蛋白的结合力。通过测定不同浓度化合物抑制 Flu-BakBH3 与 Bcl-2 结合的能力而测评不同化合物与 Bcl-2 蛋白的结合亲和力。
细胞实验	**Cell lines:** HF1A3, HF4.9 和 HF28RA **Concentrations:** 0-25 µM **Incubation Time:** 20 小时 **Method:** 通过 MTT 法测定 HA14-1 作用于不同 FL 细胞系的毒性。在有或无 HA14-1 的情况下，细胞(5000/每孔)按一式三份在 96 孔板中 37°C 下温育 20 小时。然后每孔加入 MTT 溶液。在 37°C 下温育 4 小时后，使用 96 孔板酶标仪测定光密度(OD)。使用以下公式: 细胞存活百分数=(实验组 OD 值/对照组 OD 值) × 100。绘制 S 型剂量反应曲线，使用 Prism 4.0 软件计算 50% 致死浓度值(LC50) 。
动物实验	**Animal Models:** 携带 BeGBM 移植瘤的雌性 Swiss 裸鼠 **Formulation:** HA14-1 在 100 µL free RPMI 1640-50% DMSO 中配制 **Dosages:** 400 nM **Administration:** 在细胞注射位点注射

【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。