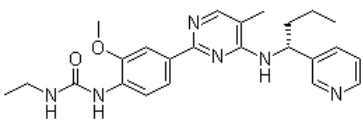


## CYT997

产品编号: MB4037  
质量标准: >98%  
包装规格: 5MG;10MG;50MG  
产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C24H30N6O2	结 构 式	
分子量	434.53		
CAS No.	917111-44-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO: 86 mg/mL (197.91 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol: 20 mg/mL (46.02 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:** Lexibulin(CYT-997)是微管蛋白聚集强效抑制剂, 体外体内具有高效的细胞毒性和血管增生阻断作用。

**别名:** CYT-997; Urea,

N-ethyl-N'-[2-methoxy-4-[5-methyl-4-[[[(1S)-1-(3-pyridinyl)butyl]amino]-2-pyrimidinyl]phenyl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....白色至类白色固体

溶解性: .....DMSO: 86 mg/mL (197.91 mM); Water Insoluble; Ethanol: 20 mg/mL (46.02 mM)

含量: .....>98%

**储存条件:** -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Lexibulin (CYT997)作用于癌细胞系, 是一种有效的 microtubule (微管) 聚合抑制剂, IC50 为 10-100 nM。
<b>特性</b>	不同于多种其他微管蛋白靶向药剂(MTAs), CYT997 可用于口服处理, 且有效作用于 MDR <sup>+</sup> 细胞系。
<b>靶点</b>	Microtubules (cancer cell lines) 10 nM-100 nM
<b>体外研究</b>	CYT997(1 μM)处理 A549 细胞 24 小时, 诱导微管快速重组, 包括现有的微管网络遭破坏, 及一些细胞质微管蛋白在菌斑处累积, 导致细胞形态发生显著变化, 包括粘附细胞丢失, 细胞减少。CYT997 作用于 16 种癌细胞具有毒性, IC50 为作用于 HepG2 细胞的 9 nM 到作用于 KHOS/NP 细胞的 101 nM。CYT997 有效作用于 HCT15 细胞, 具有多耐药机制 Pgp(MDR <sup>+</sup> ), IC50 为 52 nM。CYT997 通过抑制微管聚合, 使细胞周期停在 G2-M 分界处, 且诱导磷酸化的 Bcl-2 增多, 也提高 cyclin B1 表达, caspase-3 激活, 以及 PARP 的产生。CYT997 处理 1 小时后, 引起 HUVEC 单层膜通透性快速且可逆的提高, IC50 为~80 nM。与 CYT997 破坏细胞微管蛋白相一致, CYT997

有效抑制增殖，诱导细胞周期停滞，且诱导人骨髓细胞系(HMCLs)和原代 MM 细胞凋亡。

**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)**

MB4036	ABT-751 (E7010)
MB1972	Combretastatin A4
MB1403	Cabazitaxel

**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。Lexibulin (CYT997) 作用于癌细胞系，是一种有效的 microtubule (微管) 聚合抑制剂，体外体内具有高效的细胞毒性和血管增生阻断作用。

**储液配置**

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.3013 mL	11.5067 mL	23.0134 mL
5 mM	0.4603 mL	2.3013 mL	4.6027 mL
10 mM	0.2301 mL	1.1507 mL	2.3013 mL
50 mM	0.0460 mL	0.2301 mL	0.4603 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p>微管蛋白聚合比浊法: 通过传统比浊法使用牛神经元微管蛋白测定 CYT997 作用于微管蛋白聚合的效果, 在 340 nm 处通过测定吸光值的增高而监测微管装配。浓度不断增高的 CYT997 加到 100 μL 微管蛋白/GTP/甘油中。通过试管中牛微管蛋白在 PEM buffer[80 nM PIPES (pH 6.9), 2 mM MgCl<sub>2</sub>, 0.5 mM EGTA, 及 5% 甘油]中 37°C 下温育, 然后在恒温控制下使用分光光度计测定 340 nm 处的吸光值变化, 而进行微管组装的比浊测定。</p>
<b>细胞实验</b>	<p>Cell lines: DU145, A549, Ramos, KHOS/NP, A375, HCT-15, HT1376, BT-20, A431, PA-1, U937, HepG2, TF-1, Baf3/TelJAK2, PC3, 和 K562 Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为~1 μM Incubation Time: ~72 小时 Method: 使用不同浓度 CYT997 处理细胞 72 小时。然后使用 Alamar blue 或 MTT 实验测定细胞增殖。MTT 实验中, 每孔加入 5 mg/mL MTT, 实验板在 37°C 下温育 6 小时, 然后加入溶解 buffer(10% SDS, 溶于 0.01 N HCl), 使用 BMG Technologies Lumistar 或 Polarstar 酶标仪在 620 nm 处测定吸光值。Alamar blue 实验中, 每孔加入 Alamar blue(10 μL/每孔), 实验板在 37°C 下温育 4 小时。使用荧光酶标仪测量荧光, 在 544 nm 处测定激发光, 在 590 nm 处测定发射光。细胞周期分析中, 混合细胞, 使用溶于 PBS 的 70%乙醇使细胞渗透, 然后在 4°C 温育过夜。使用碘化丙啶 (5 μg/mL) 在 4°C 下对 RNase 处理的样本(10 μg RNase/mL, 在 37°C 下处理 20 分钟)染色 10 分钟。通过荧光激活细胞分选(FACS)分选, 使用 Beckman-Coulter Quanta SC MPL 系统测定细胞周期变化, 使用 CXP 软件分析。凋亡分析中, 分离细胞, 然后收集。使用 Vybrant 凋亡检测试剂盒进行 Annexin 染色。细胞储存在冰上, 1 小时内在 Beckman Coulter Quanta MPL 上分析。使用双通道分析测定 Annexin V-阳性细胞。</p>

<b>动物实验</b>	<p>Animal Models: 皮下接种 PC3 细胞的雄性裸鼠, 接种 4T1 细胞的雌性 BALB/c 小鼠</p> <p>Formulation: 在 NMP/PEG300/盐水中配制</p> <p>Dosages: ~30 mg/kg/day</p> <p>Administration: 口服饲喂, 每天三次</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。