

## ABT263 (Navitoclax) ; ABT-263

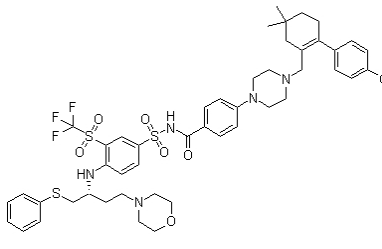
产品编号 : MB4611

质量标准 : >98% , Bcl-xL, Bcl-2 和 Bcl-w 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

### 基本信息

分子式	C47H55ClF3N5O6S3	结 构 式	
分子量	974.61		
CAS No.	923564-51-6		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (102.6 mM)		
	Water : Insoluble		
	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:** Navitoclax (ABT-263) 是有效, 可口服的 Bcl-2 抑制剂, 可与 Bcl-x<sub>L</sub>, Bcl-2, Bcl-w 等多种 Bcl-2 家族蛋白结合。

**别名:** 生根粉 263 ; ABT-263 ; 4-[4-[[2-(4-chlorophenyl)-5,5-dimethyl-1-cyclohexen-1-yl]methyl]-1-piperazinyl]-N-[[4-[[[(1R)-3-(4-morpholinyl)-1-[(phenylthio)methyl]propyl]amino]-3-[(trifluoromethyl)sulfonyl]phenyl]sulfonyl]-benzamide

### 物理性状及指标 :

外观 : .....白色至类白色固体

溶解性 : .....DMSO : 100 mg/mL (102.6 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

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>	Navitoclax (ABT-263)是一种有效的 Bcl-xL ,Bcl-2 和 Bcl-w 抑制剂，无细胞试验中 $K_i$ 分别为 $\leq 0.5$ nM， $\leq 1$ nM 和 $\leq 1$ nM，但与 Mcl-1 和 A1 结合微弱。Phase 2。		
<b>靶点</b>	Bcl-xL (Cell-free assay)  $<=0.5$ nM(Ki)	Bcl-2 (Cell-free assay)  $<=1$ nM(Ki)	Bcl-w (Cell-free assay)  $<=1$ nM(Ki)
<b>体外研究</b>	ABT-263 有效抑制 Bcl-2 蛋白家族，用荧光偏振分析法测试 ABT-263 作用于 Bcl-xL, Bcl-2 和 Bcl-w 时， $K_i$ 分别为 0.5, 1 和 1 nM。ABT-263 结构上与 ABT-737 相关。ABT-263 阻断 Bcl-2 和 Bcl-XL 与凋亡前体蛋白相互作用。Bcl-2 家族成员 Bcl-2, Bcl-XL, 和 Mcl-1 的过量表达通常都与肿瘤的修复及抗药性有关。ABT-263 作用于过量表达的 Bcl-2 和 Bcl-XL 时显示出保护作用，EC50 分别为 60 和 20 nM。ABT-263 作用于不同的细胞显示出不同的细胞活性，作用于 H146 细胞系时 EC50 为 110nM, 而作用于 H82 细胞系时 EC50 为 22 $\mu$ M。ABT-737 可以有效作用于四种 EC50 值 $<400$ nM 的细胞系，即 H146, H889, H1963, 和 H1417。而两种抗 ABT-737 的细胞系，即 H1048 和 H82，同样也显示出抗 ABT-263 的特性。		
<b>体内研究</b>	用 ABT-263 处理 H345 移植瘤模型，按动物体重，每千克每天处理 10mg ABT-263，结果肿瘤生长抑制率达 80%，肿瘤体积减小了 50%以上，显示出 ABT-263 极强的抗癌效果。ABT-263 作用于非小细胞肺癌和急性淋巴细胞白血病的移植瘤模型时，每天单独口服，结果显示肿瘤完全衰退。ABT-263 单独作用于 B-细胞淋巴瘤和多发性骨髓瘤的移植瘤模型时效果不明显，但是可以显著增强临床其他相关用药的药性。		

**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)**

MB3970	<u>HA14-1</u>
MB7034	<u>奥巴克拉甲磺酸盐</u>
MB7269	<u>ABT-199(GDC-0199)</u>

**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。Navitoclax (ABT-263) 是有效，可口服的 Bcl-2 抑制剂，可与 Bcl-xL, Bcl-2, Bcl-w 等多种 Bcl-2 家族蛋白结合。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

体 浓	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg

1 mM	1.0261 mL	5.1303 mL	10.2605 mL
5 mM	0.2052 mL	1.0261 mL	2.0521 mL
10 mM	0.1026 mL	0.5130 mL	1.0261 mL
50 mM	0.0205 mL	0.1026 mL	0.2052 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>激酶实验:</b></p> <p>用竞争性荧光偏振检测测定 ABT-263 作用于 Bcl-2 家族不同亚型的 Ki 值或者 IC50 值。使用如下的肽探针对或者蛋白对 : f-bad (1 nM) 和 Bcl-xL (6 nM), f-Bax (1 nM) 和 Bcl-2 (10 nM), f-Bax (1 nM) 和 Bcl-w (40 nM), f-Noxa (2 nM)和 Mcl-1 (40 nM), 及 f-Bax (1 nM) 和 Bcl-2-A1 (15 nM)。用时间分辨荧光共振能量转移法测定 ABT-263 和 Bcl-xL 作用的结合紧密度。1 nM 用 His 标记的 Bcl-xL 与 200 nM f-Bak,及 1 nM Tb 标记的 His 抗体混合, 然后在室温下处理 30 分钟。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> SCLC 细胞系</p> <p><b>Concentrations:</b> 0-1 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b></p> <p>人类肿瘤细胞系在 37°C 含 5% CO<sub>2</sub> 环境下获得, SCLC 细胞系培养在 RPMI 1640 培养基中, 培养基包含 10% 胎牛血清, 1% 丙酮酸钠, 25 mM HEPES, 4.5 g/L 葡萄糖, 1% 青霉素/链霉素。用含有 10% FBS 和 1% 青霉素/链霉素的 RPMI 1640 培养基培养白血病和淋巴瘤细胞系。细胞在 96 孔板上处理 48 小时, 最终体积达到 100ul。在体外测试 ABT-263 的细胞毒性。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> C.B.-17 严重联合免疫缺陷-米黄鼠</p> <p><b>Formulation:</b> ABT-263 在 10% 乙醇, 30% 聚乙二醇 400, 及 60% Phosal 50 PG 中制成</p> <p><b>Dosages:</b> 100 mg/kg/d</p> <p><b>Administration:</b> 口服处理</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。