

Obatoclox Mesylate ; GX15-070 ; 奥巴克拉甲磺酸盐

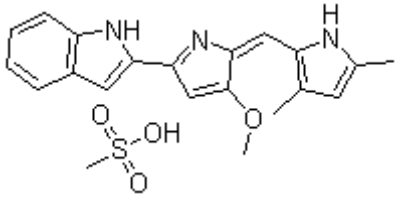
产品编号 : MB7034

质量标准 : ≥98%, Bcl-2 拮抗剂

包装规格 : 10MG;50MG;200MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₀ H ₁₉ N ₃ O ₃ ·CH ₄ O ₃ S	结 构 式	
分子量	413.49		
CAS No.	803712-79-0		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 83 mg/mL (200.73 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 : 奥巴克拉 Obatoclox 是 BCL-2 家族蛋白的拮抗剂。

别名 : Obatoclox Mesylate; GX15-070 ; 1H-Indole, 2-[2-[(3,5-dimethyl-1H-pyrrol-2-yl)methylene]-3-methoxy-2H-pyrrol-5-yl]-, methanesulfonate (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :紫色至黑色固体

溶解性 :DMSO : 83 mg/mL (200.73 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

产品描述	Obatoclox Mesylate (GX15-070)是一种 Bcl-2 拮抗剂, 无细胞试验中 K _i 为 0.22 μM, 可以协助抑制 MCL-1 介导的抗细胞凋亡作用。
特性	Obatoclox 是有应用前景的小分子 Bcl-2 拮抗剂, 抑制 Bcl-2 蛋白家族所有相关的膜结构, 包括 Mcl-1。
靶点	Bcl-2

	(Cell-free assay)
	0.22 μ M(Ki)
体外研究	5 μ M Obatoclax 作用于 SK-Mel5 细胞完全抑制 Mcl-1 参与的 Bak 修复，且阻断由 Mcl-1 引起的抗 ABT-373 诱导的 KB/Bcl-2 细胞凋亡。Obatoclax 是拟 BH3，可以与许多 Bcl-2 家族成员结合，包括 Bcl-2, Bcl-xL, 和 Mcl-1。Obatoclax 特异取代 Mcl-1 的激活 BH3 域，随后引起 Bak 低聚反应和细胞色素 C 释放调节的细胞凋亡。Obatoclax 可有效作用于缺乏 Bcl-xL 或 Bcl-xL 低表达的细胞系，Obatoclax 作用于所有强表达 Mcl-1, Bcl-2, 和 Bcl-xL 的细胞系时显示出较低的细胞毒性。Obatoclax 抑制多发性骨髓瘤细胞 (MM) 系如 KMS12PE, KMS18, MY5 等等，IC50 值为 52 到 1100nM。当有浓度为 150 nmol 的抗细胞毒素剂 IL-6 或 IGF-1 存在时，也可观察到抑制作用。Obatoclax 增强 melphalan, dexamethasone, 或 bortezomib 的抗骨髓瘤活性。Obatoclax 加强肿瘤坏死因子相关凋亡诱导配体 (TRAIL) 调节的细胞凋亡。

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)

MB7269	ABT-199(GDC-0199)
MB4611	ABT-263 (Navitoclax)
MB3970	HA14-1

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。本品奥巴克拉 Obatoclax 是 BCL-2 家族蛋白的拮抗剂，可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4184 mL	12.0922 mL	24.1844 mL
5 mM	0.4837 mL	2.4184 mL	4.8369 mL
10 mM	0.2418 mL	1.2092 mL	2.4184 mL
50 mM	0.0484 mL	0.2418 mL	0.4837 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	Bcl-2 结合实验: 使用 SIE 计分函数计算 Obatoclax 与 BCL-2 的结合力。[4] 为了确定实验的准确性，计算一组 12 个小分子与 BCL-2 的结合亲和力。
细胞实验	Cell lines: 人类多发性骨髓瘤细胞 (MM)，外周血淋巴细胞(PBLs)，及髓基质细胞(BMSCs) Concentrations: 10 μ M 左右

	<p>Incubation Time: 48-72 小时</p> <p>Method: Obatoclax 溶解在 DMSO 中, 浓度为 5 mM。通过 MTT 实验测细胞活力。人类多发性骨髓瘤细胞 (MM), 外周血淋巴细胞(PBLs), 及髓基质细胞(BMSCs)按每孔 2×10^4(HMCLs) 或 $5 \sim 10 \times 10^3$(PBLs)密度接种在 96 孔板上。加入不同浓度的 Obatoclax, 实验组加入 IGF-1(50 ng/mL)或 IL-6(10 ng/mL), 对照组不加。细胞温育 48 到 72 小时, 测定细胞活力。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 SW480, C33A, PC3,和 4T1 细胞的雌性 BALB/c 或 CB17 SCID/SCID 鼠。</p> <p>Formulation: Obatoclax 在 9.6%聚乙二醇 300, 0.4% Tween-20, 及 5% 葡聚糖的混合物中配制; 然而用于 4T1 肿瘤模型实验时, Obatoclax 在浓度为 0.6 mg/ml 包含 9.48%聚乙二醇 300, 0.38% Tween-20, 1.2 mg/ml 甘露醇,及 5% 葡聚糖的混合物中配制。</p> <p>Dosages: 0.0313, 0.25, 0.5, 和 2 mg/kg</p> <p>Administration: 在鼠尾部静脉注射, 每天一次。</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 产品分类: 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。