

### ABT-199 (GDC-0199); ABT199, Venetoclax

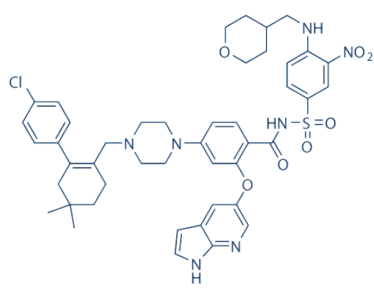
产品编号: MB7269

质量标准: >98%, Bcl-2 选择性抑制剂

包装规格: 10MG; 50MG; 200MG

产品形式: solid

#### 基本信息

分子式	C45H50ClN7O7S	结 构 式	
分子量	868.44		
CAS No.	1257044-40-8		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25° C)	DMSO 100 mg/mL (115.15 mM) Water Insoluble Alcohol 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:** Venetoclax (GDC-0199; ABT-199) 是一种高效, 有选择性和口服活性的 Bcl-2 抑制剂。

**别名:** 维奈妥拉 ; GDC-0199; ABT-199; Benzamide,

4-[4-[[2-(4-chlorophenyl)-4,4-dimethyl-1-cyclohexen-1-yl]methyl]-1-piperazinyl]-N-[[3-nitro-4-[[[(tetrahydro-2H-pyran-4-yl)methyl]amino]phenyl]sulfonyl]-2-(1H-pyrrolo[2,3-b]pyridin-5-yl)oxy]-

#### 物理性状及指标:

外观: .....淡黄色至黄色固体

溶解性: .....DMSO 100 mg/mL (115.15 mM); Water Insoluble; Alcohol 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	Venetoclax (ABT-199, GDC-0199) 是一种 Bcl-2 选择性抑制剂, 无细胞试验中 $K_i$ 为 <0.01 nM, 比作用于 Bcl-xL 和 Bcl-w 选择性高 4800 倍以上, 对 Mcl-1 没有抑制活性。Phase 3。
特性	ABT-263 (Navitoclax) 的重组
靶点	Bcl-2 (Cell-free assay) <0.01 nM( $K_i$ )
体外研究	ABT-199 对 Bcl-xL, Mcl-1 和 Bcl-w 具有低的敏感性, $K_i$ 分别为 48 nM, >444 nM 和 245 nM。ABT-199 有效抑制 FL5.12-Bcl-2 细胞, RS4;11 细胞, $EC_{50}$ 分别为 4 nM 和 8 nM, 作用于

<b>体内研究</b>	<p>FL5.12-Bcl-xL 细胞具有低活性, EC50 为 261 nM。ABT-199 诱导 RS4;11 细胞快速凋亡, 细胞色素 c 释放, caspase 激活, 磷脂酰丝氨酸外化, 及 sub-G0/G1 DNA 积累。定量免疫印迹表明 ABT-199 对包括 NHL, DLBCL, MCL, AML 和 ALL 细胞系的灵敏度, 与 Bcl-2 的表达强烈相关。ABT-199 也诱导 CLL 凋亡, 平均 EC50 为 3.0 nM。</p> <p>ABT-199 (100 mg/kg) 处理 RS4;11 移植瘤, 产生的最大肿瘤生长抑制率为 95%, 肿瘤生长延迟 152%。ABT-199 单独处理或与 SDX-105 及其他药剂联用处理 DoHH2 和 Granta-519 移植瘤, 也抑制肿瘤生长。</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)**

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。Venetoclax (GDC-0199; ABT-199) 是一种高效, 有选择性和口服活性的 Bcl-2 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置:**

体 DMSO 质量 浓度	积 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.1515 mL	5.7575 mL	11.5149 mL
5 mM	0.2303 mL	1.1515 mL	2.3030 mL
10 mM	0.1151 mL	0.5757 mL	1.1515 mL
50 mM	0.0230 mL	0.1151 mL	0.2303 mL

**经典实验操作 (来源于公开文献, 仅供参考)**

<b>激酶实验</b>	<p><b>亲和力分析:</b></p> <p>竞争性荧光偏振检测测定 ABT-199 对 Bcl-2 家族的不同亚型的亲和力 (<math>K_i</math> 或 <math>IC_{50}</math>)。使用如下肽探针/蛋白对: f-bad (1 nM) 与 Bcl-xL (6 nM), f-Bax (1 nM) 与 Bcl-2 (10 nM), f-Bax (1 nM) 与 Bcl-w (40 nM), f-Noxa (2 nM) 与 Mcl-1 (40 nM), 及 f-Bax (1 nM) 与 Bcl-2-A1 (15 nM)。使用时间分辨荧光共振能量转移检测测定对 Bcl-xL 的亲和力。Bcl-xL (1 nM, His 标记的) 与 200 nM f-Bak, 1 nM Tb 标记的 anti-His 抗体, 及 ABT-199, 在室温下混合 30 分钟。在 Envision 酶标仪上, 使用 340/35 nm 激发滤光片及 520/525 (f-Bak) 和 495/510 nm (Tb 标记的 anti-His 抗体) 发射滤光片, 测量荧光值。</p>
<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> NHL, DLBCL, MCL, AML 和 ALL 细胞系</p> <p><b>Concentrations:</b> ~1 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> RS4;11 细胞按每孔 <math>5 \times 10^4</math> 个接种在 96 孔板中, 使用初始 1 <math>\mu</math>M-0.05 nM。在半对数期稀释的 ABT-199 处理细胞。白血病和淋巴瘤细胞系按每孔 <math>1.5-2 \times 10^4</math> 个接种在合适的培养基中, 与 ABT-199 温育 48 小时。使用 Cell TiterGlo 试剂测定对细胞增殖的影响。通过对浓度-反应数据非线性回归分析测定 EC50 值。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 雌性 C.B-17 SCID 小鼠 (携带 DoHH2 和 Granta-519 移植瘤) 和雌性 C.B-17 SCID-beige 小鼠 (携带 RS4;11 和 Toledo 移植瘤)</p>

<b>Formulation:</b> 60% Phosal 50 丙二醇(PG), 30%聚乙二醇(PEG) 400 和 10% 乙醇
<b>Dosages:</b> ~100 mg/kg
<b>Administration:</b> 口服处理

**【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。