

HB181128

Venetoclax (ABT-199)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
Venetoclax(ABT-199)	50803ES08	5 mg
Venetoclax(ABT-199)	50803ES25	25 mg

产品描述

Venetoclax 又称为 ABT-199、GDC-0199, 强效的、选择性的抑制 Bcl-2 ($K_i < 0.01$ nM), 比作用于 Bcl-xL 和 Bcl-w 选择性高 4800 倍以上。Venetoclax 抑制 Bcl-2 依赖的细胞生长, 并抑制体内移植瘤生长。Venetoclax 表现出抗白血病活性。

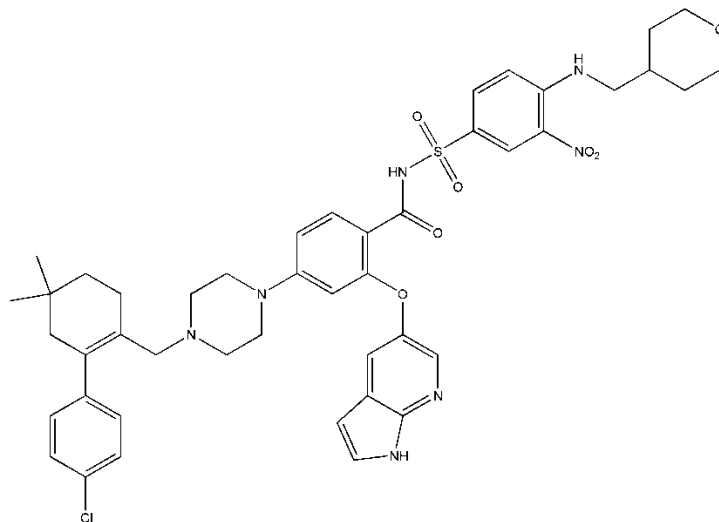
目前, Venetoclax 已用于临床 Phase 3 研究阶段。

【该产品仅用于科研实验, 不能用于人体】

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GDC-0199, ABT199, ABT-199, GDC 0199
化学名 (Chemical Name)	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-yloxy)-benzamide
靶点 (Target)	Bcl-2
CAS 号 (CAS NO.)	1257044-40-8
分子式 (Molecular Formula)	$C_{45}H_{50}ClN_7O_7S$
分子量 (Molecular Weight)	868.44
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO (50 mg/ml)

结构式 (Structure)



运输与保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20 °C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后 -20 °C 避光保存, 避免反复冻存, 至少可存放 6 个月。

注意事项

- 1) 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 2) 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 3) 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件(如实验目的, 细胞种类, 培养特性等)进行摸索和优化。】

相关实验(数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验(体外研究)

为检测 Venetoclax 对细胞的作用, 用不同浓度 Venetoclax (0.05 nM-1 μ M) 孵育 RS4;11 细胞、白血病和淋巴瘤细胞, 检测细胞增殖情况, Venetoclax 有效抑制 FL5.12-Bcl-2 细胞、RS4;11 细胞, EC₅₀ 分别为 4 nM 和 8 nM, 作用于 FL5.12-Bcl-xL 细胞具有低活性, EC₅₀ 为 261 nM。Venetoclax 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。^[2]

(二) 动物实验(体内研究)

体内研究中, 建立 bim^{+/+}或 bim^{-/-} myc/bcl-2 移植瘤小鼠模型, 小鼠口服 100 mg/kg Venetoclax, Venetoclax 在小鼠体内迅速发挥作用, WBC 数量在 3 个小时内明显减少。^[3]

参考文献

- [1] Davids MS, et al. ABT-199: A new hope for selective BCL-2 inhibition. *Cancer Cell* 23(2): 139-141 (2013).
- [2] Souers AJ, et al. ABT-199, a potent and selective BCL-2 inhibitor, achieves antitumor activity while sparing platelets. *Nat. Med.* 19(2): 202-208 (2013).
- [3] Vandenberg CJ, et al. ABT-199, a new Bcl-2-specific BH3 mimetic, has in vivo efficacy against aggressive Myc-driven mouse lymphomas without provoking thrombocytopenia. *Blood* 121: 2285-2288 (2013).