

HB181128

ABT-737

产品信息

产品名称	产品编号	规格
ABT-737	50805ES08	5mg
ABT-737	50805ES25	25mg
ABT-737	50805ES60	100mg

产品描述

ABT-737 是一种有效的、细胞通透性的 Bcl-2 蛋白抑制剂, 与 Bcl-xL, Bcl-2 和 Bcl-w 亲和力很高 ($K_i < 1$ nM), EC_{50} 分别为 78.7 nM, 30.3 nM 和 197.8 nM; 但对 Mcl-1、Bcl-B 及 Bfl-1 没有抑制作用。ABT-737 干扰癌细胞中 Bcl-2 家族蛋白的相互作用, 并诱导癌细胞凋亡, 另外, 在移植瘤动物体内, ABT-737 可以引起肿瘤快速衰退。

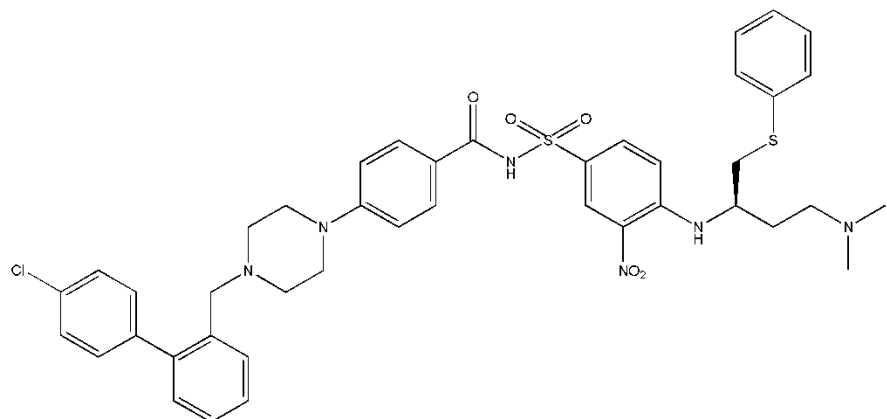
目前, ABT-737 已用于临床 Phase 2 研究阶段。

【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)	ABT737, ABT 737
化学名 (Chemical Name)	4-[4-[(4'-chloro[1,1'-biphenyl]-2-yl)methyl]-1-piperazinyl]-N-[[4-[[[(1R)-3-(dimethylamino)-1-[(phenylthio)methyl]propyl]amino]-3-nitrophenyl]sulfonyl]-benzamide
靶点 (Target)	Bcl-2
CAS 号 (CAS NO.)	852808-04-9
分子式 (Molecular Formula)	$C_{42}H_{45}ClN_6O_5S_2$
分子量 (Molecular Weight)	813.4
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	$\geq 98\%$
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

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 ABT-737 对淋巴细胞的作用, 不同浓度的 ABT-737 (0.0001-10 μM) 孵育 B 细胞和 T 细胞, anti-IgM 激活正常的人 B 细胞, 而 ABT-737 抑制 B 淋巴细胞增殖, IC_{50} 为 0.08 μM ; 相同地, 使用 anti-CD3 刺激 T 细胞, ABT-737 抑制 T 细胞增殖, IC_{50} 为 0.40 μM 。^[2]

(二) 动物实验(体内研究)

体内实验中, 用 ABT-737 (50、25、5 mg/kg) 处理 KLH C57BL/6/J 小鼠, 50 mg/kg ABT-737 完全抑制 KLH 刺激的 T 细胞增殖。^[2]

参考文献

- [1] Konopleva M, et al. Mechanisms of apoptosis sensitivity and resistance to the BH3 mimetic ABT-737 in acute myeloid leukemia. *Cancer Cell* 10(5): 375-388 (2006).
- [2] Bardwell PD, et al. The Bcl-2 Family Antagonist ABT-737 Significantly Inhibits Multiple Animal Models of Autoimmunity. *J Immunol* 182: 7482-7489 (2009).
- [3] Klymenko T, et al. The Novel Bcl-2 Inhibitor ABT-737 Is More Effective in Hypoxia and Is Able to Reverse Hypoxia-Induced Drug Resistance in Neuroblastoma Cells. *Mol Cancer Ther* 10(12): 2373-2383 (2011).
- [4] M é rino D, et al. Bcl-2, Bcl-xL, and Bcl-w are not equivalent targets of ABT-737 and navitoclax (ABT-263) in lymphoid and leukemic cells. *Blood* 119: 5807-5816 (2012).
- [5] Parrondo R, et al. ABT-737, a small molecule Bcl-2/Bcl-xL antagonist, increases antimitotic-mediated apoptosis in human prostate cancer cells. *Peer J*. 1: e144 (2013).