

HB181205

CYT997 (Lexibulin)

产品信息

产品名称	产品编号	规格
CYT997 (Lexibulin)	51302ES08	5mg
CYT997 (Lexibulin)	51302ES25	25mg

产品描述

CYT997 (Lexibulin)是一种有效的微管聚合抑制剂,对多种肿瘤细胞具有细胞毒性,抑制细胞生长和增殖,并诱导细胞凋亡,使细胞停留在细胞周期的 G2/M 期。CYT997 具有口服生物活性,在临床前肿瘤模型中表现出显著的血管裂解(vascular-disrupting)活性,抑制肿瘤扩大。CYT997 与 bortezomib 联合使用会产生更强的抗肿瘤活性。

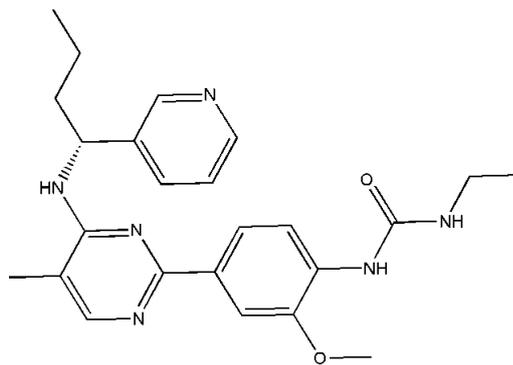
目前, CYT997 已用于临床 Phase 2 研究阶段。

【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)	Lexibulin
化学名 (Chemical Name)	1-ethyl-3-[2-methoxy-4-[5-methyl-4-[[[(1S)-1-pyridin-3-ylbutyl]amino]pyrimidin-2-yl]phenyl]urea
靶点 (Target)	Tubulin (microtubules)
CAS 号 (CAS NO.)	917111-44-5
分子式 (Molecular Formula)	C ₂₄ H ₃₀ N ₆ O ₂
分子量 (Molecular Weight)	434.53
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输与保存方法

粉末直接保存于-20 ℃,有效期2年。溶于 DMSO。建议分装后-20 ℃ 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）

- 1) 为检测 CYT997 对人 AML 细胞和 K562 细胞的作用，分别用 12.5、25、50、100、200 nM CYT997 孵育细胞 24h 或 48h，CYT997 抑制所有待检测细胞生长，其作用方式为浓度和时间依赖型，HL-60 和 Kasumi-1 对 CYT997 尤其敏感。IC50 值分别为 60.75 nM (HL-60)、111.38 nM (KG-1)、96.06 nM (THP-1)、71.43 nM (Kasumi-1) 和 134.33 nM (HEL)。^[1]
- 2) 为检测 CYT997 对细胞周期的影响，用 1 μ M CYT997 处理 A431 细胞 15h 或 24h，对照组 15% 和 19% 细胞处于 G2/M 期，CYT997 处理组则有 38% 和 43% 细胞处于 G2/M 期。^[2]

（二）动物实验（体内研究）

- 1) 为检测 CYT997 的活性，分别给 PC3 和 4T1 移植瘤小鼠口服 CYT997 (7.5, 15, 25–30 mg/kg/d)，CYT997 以剂量依赖的方式抑制肿瘤生长，而 30 mg/kg/d 时某些小鼠出现精神萎缩，表现出耐受性。^[2]
- 2) 在体内研究中，肝癌转移小鼠腹腔注射 CYT997 (5、10、15mg/kg/day, b.i.d.)，10、15mg/kg CYT997 处理组肿瘤显著变小，肝转移率也显著降低，作用方式为剂量依赖型。^[3]

参考文献

- [1] Chen XH, et al. The microtubule depolymerizing agent CYT997 effectively kills acute myeloid leukemia cells via activation of caspases and inhibition of PI3K/Akt/mTOR pathway proteins. *Experimental and Therapeutic Medicine*, 6(2): 299-304 (2013).
- [2] Burns CJ, et al. CYT997: a novel orally active tubulin polymerization inhibitor with potent cytotoxic and vascular disrupting activity in vitro and in vivo. *Mol Cancer Ther*, 8(11): 3036-3045 (2009).
- [3] Burns CJ, et al. The Microtubule Depolymerizing Agent CYT997 Causes Extensive Ablation of Tumor Vasculature In Vivo. *JPET* 339(3): 799-806 (2011).
- [4] Monaghan K, et al. CYT997 Causes apoptosis in human multiple myeloma. *Investigational New Drugs* 29(2): 232–238 (2011).