

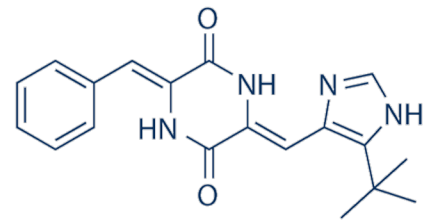
Plinabulin (血管阻断剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1130-10mM	Plinabulin (血管阻断剂)	10mM×0.2ml
SC1130-5mg	Plinabulin (血管阻断剂)	5mg
SC1130-25mg	Plinabulin (血管阻断剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	Bertelsen LB, et al. Int J Radiat Biol, 2011, 87(11), 1126-1134.
简称	Plinabulin
别名	NPI-2358, NPI 2358, NPI2358, NPI-2358, NPI2358, NPI 2358
中文名	普那布林
化学式	C ₁₉ H ₂₀ N ₄ O ₂
分子量	336.39
CAS号	714272-27-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 54mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.49ml DMSO, 或每3.36mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1130-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Plinabulin (NPI-2358)是一种vascular disrupting agents(VDA)(血管阻断剂), 作用于肿瘤细胞, 影响微管蛋白解聚, IC ₅₀ 为9.8~18nM。Phase 1/2。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	Tubulin	—	—	—	—
IC ₅₀	9.8nM-18nM	—	—	—	—
体外研究	NPI-2358结合到tubulin的秋水仙素结合位点, 有效抑制过量表达Pgp的人类肿瘤细胞系, 或降低核Topo II催化活性, IC ₅₀ 为9.8到18nM。NPI-2358浓度为20nM作用于人脐静脉内皮细胞能快速诱导tubulin解聚, 且透过单细胞层。NPI-2358作用于MM细胞, 使MM细胞停在有丝分裂早期, 而诱导细胞死亡。NPI-2358也抑制微管形成, 及内皮细胞和MM细胞的迁移, 使肿瘤脉管系统功能失常。NPI-2358可诱导细胞死亡, 不影响其他正常单核细胞的活力。NPI-2358诱导有丝分裂停滞或MM细胞死亡, 但是阻断JNK通路可使这种诱导作用失活。				
体内研究	NPI-2358(7.5mg/kg)作用于携带人浆细胞移植瘤的鼠, 抑制肿瘤生长。NPI-2358诱导肿瘤灌注降低, 存在时间和剂量依赖性。NPI-2358作用于KHT肉瘤, 比作用于C3H肿瘤效果更好, 辐射处理可以增强两种肿瘤的抗癌活性。				
临床实验	N/A				
特征	NPI-2358是NPI-2350的人工合成物, 比NPI-2350更有效。				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	N/A

细胞实验	
细胞系	HT-29, PC-3, DU 145, MDA-MB-231, NCI-H292, Jurkat, MES-SA, MES-SA/Dx5, HL-60, HL-60/MX2
浓度	2pM到20μM
处理时间	24小时
方法	粘附细胞接种在96孔板上, 37°C下粘附24小时。加入NPI-2358, 同一天在96孔板上接种HL-60和HL-60/MX2细胞。加入连续稀释的NPI-2358, 浓度为2pM到20μM。用终浓度为0.25% (v/v) DMSO处理细

	胞，作为对照。使用荧光计测量resazurin的降低量，48小时后测定细胞活力。计算IC50值。
--	--

动物实验	
动物模型	CDF1 鼠或C3H/HeJ 鼠
配制	储备在聚乙二醇/solutol溶液中，用5%葡萄糖稀释到所需浓度。
剂量	15mg/kg
给药方式	按0.02ml/g剂量腹腔注射到CDF1 鼠内，按0.01ml/g剂量皮下注射到C3H/HeJ 鼠内。

➤ **参考文献:**

- 1.Nicholson B, et al. Anticancer Drugs. 2006, 17(1), 25-31.
- 2.Singh AV, et al. Blood. 2011, 117(21), 5692-5700.
- 3.Bertelsen LB, et al. Int J Radiat Biol, 2011, 87(11), 1126-1134.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC1130-10mM	Plinabulin (血管阻断剂)	10mM×0.2ml
SC1130-5mg	Plinabulin (血管阻断剂)	5mg
SC1130-25mg	Plinabulin (血管阻断剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉淀至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其他相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积的等效剂量转换表请参考如下网页：
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01