

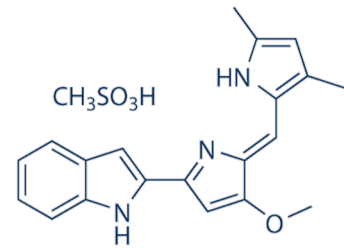
## Obatoclast Mesylate (Bcl-2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4381-10mM	Obatoclast Mesylate (Bcl-2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4381-5mg	Obatoclast Mesylate (Bcl-2抑制剂)	5mg
SC4381-25mg	Obatoclast Mesylate (Bcl-2抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(2Z)-2-[(5Z)-5-[(3,5-dimethyl-1H-pyrrol-2-yl)methylidene]-4-methoxypyrrol-2-ylidene]indole;methanesulfonic acid
简称	Obatoclast Mesylate
别名	GX15-070, GX015-070, GX-15-070, GX 15-070
中文名	甲磺酸奥巴拉克
化学式	C <sub>20</sub> H <sub>19</sub> N <sub>3</sub> O·CH <sub>4</sub> O <sub>3</sub> S
分子量	413.49
CAS号	803712-79-0
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 83mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.21ml DMSO, 或每4.13mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4381-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Obatoclast Mesylate (GX15-070)是一种Bcl-2拮抗剂, 无细胞试验中K <sub>i</sub> 为0.22μM, 可以协助抑制Mcl-1介导的抗细胞凋亡作用。Phase 3。			
信号通路	Apoptosis			
靶点	Bcl-2	—	—	—
IC <sub>50</sub>	0.22μM(K <sub>i</sub> )	—	—	—
体外研究	5μM Obatoclast作用于SK-Mel5细胞完全抑制Mcl-1参与的Bak修复, 且阻断由Mcl-1引起的抗ABT-373诱导的KB/Bcl-2细胞凋亡。Obatoclast是拟BH3, 可以与许多Bcl-2家族成员结合, 包括Bcl-2、Bcl-xL和Mcl-1。Obatoclast特异取代Mcl-1的激活BH3域, 随后引起Bak低聚反应和细胞色素C释放调节的细胞凋亡。Obatoclast可有效作用于缺乏Bcl-xL或Bcl-xL低表达的细胞系, Obatoclast作用于所有强表达Mcl-1、Bcl-2和Bcl-xL的细胞系时显示出较低的细胞毒性。Obatoclast抑制多发性骨髓瘤细胞(MM)系如KMS12PE、KMS18、MY5等等, IC <sub>50</sub> 值为52到1100nM。当有浓度为150nMol的抗细胞毒素剂IL-6或IGF-1存在时, 也可观察到抑制作用。Obatoclast增强melphalan、dexamethasone或bortezomib的抗骨髓瘤活性。Obatoclast加强肿瘤坏死因子相关凋亡诱导配体(TRAIL)调节的细胞凋亡。			
体内研究	Obatoclast作用于携带人类C33A子宫瘤的SCID鼠, 按鼠体重, 每千克处理0.5mg Obatoclast, 结果显示强抗癌活性。			
临床实验	N/A			
特征	Obatoclast是有应用前景的小分子Bcl-2拮抗剂, 抑制Bcl-2蛋白家族所有相关的膜结构, 包括 Mcl-1。			

#### ➤ 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	使用SIE计分函数计算Obatoclasts与BCL-2的结合力。为了确定实验的准确性, 计算一组12个小分子与BCL-2的结合亲和力。

细胞实验	
细胞系	人类多发性骨髓瘤细胞(MM), 外周血淋巴细胞(PBLs), 及髓基质细胞(BMSCs)
浓度	10μM左右
处理时间	48-72小时

方法	Obatoclox溶解在DMSO中，浓度为5mM。通过MTT实验测细胞活力。人类多发性骨髓瘤细胞(MM)，外周血淋巴细胞(PBLs)，及髓基质细胞(BMSCs)按每孔 $2 \times 10^4$ (HMCLs)或 $5 \sim 10 \times 10^3$ (PBLs)密度接种在96孔板上。加入不同浓度的Obatoclox，实验组加入IGF-1(50ng/ml)或IL-6(10ng/ml)，对照组不加。细胞温育48到72小时，测定细胞活力。
----	--

动物实验	
动物模型	携带SW480、C33A、PC3和4T1细胞的雌性BALB/c或CB17 SCID/SCID鼠。
配制	Obatoclox在9.6%聚乙二醇 300，0.4% Tween-20及5%葡聚糖的混合物中配制；然而用于4T1肿瘤模型实验时，Obatoclox在浓度为0.6mg/ml包含9.48%聚乙二醇300，0.38% Tween-20，1.2mg/ml甘露醇及5%葡聚糖的混合物中配制。
剂量	0.0313，0.25，0.5和2mg/kg
给药方式	在鼠尾部静脉注射，每天一次。

➤ 参考文献:

- 1.Nguyen M, et al. Proc Natl Acad Sci. 2007, 104(49), 19512-191517.
- 2.Trudel S, et al. Blood, 2009, 113(2), 299-305.
- 3.Huang S, et al. Clin Cancer Res, 2009, 15 (1), 150-159.
- 4.Naim M, et al. J Chem Inf Model, 2007, 47(1), 122-133.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC4381-10mM	Obatoclox Mesylate (Bcl-2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4381-5mg	Obatoclox Mesylate (Bcl-2抑制剂)	5mg
SC4381-25mg	Obatoclox Mesylate (Bcl-2抑制剂)	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:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，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