

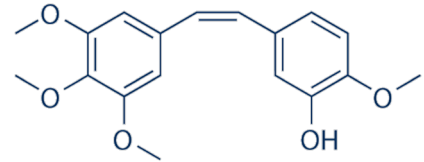
## Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC7992-10mM	Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)	10mM×0.2ml
SC7992-5mg	Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)	5mg
SC7992-25mg	Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-methoxy-5-[(Z)-2-(3,4,5-trimethoxyphenyl)ethenyl]phenol
简称	Combretastatin A4
别名	CA4DP, Ombretastatin A-4 disodium phosphate, Combretastatin A-4, Combretastatin A4 phosphate, CRC 87-09, CRC-98-09, Deoxycombretastatin A-4, Fosbretabulin, Isocombretastatin A-4, NSC 817373, NSC-817373
中文名	康普瑞汀
化学式	C <sub>18</sub> H <sub>20</sub> O <sub>5</sub>
分子量	316.35
CAS号	117048-59-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 63mg/ml; Ethanol 34mg/ml warming
溶液配制	5mg加入1.58ml DMSO, 或每3.16mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC7992-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Combretastatin A4是一种以microtubule为靶点的试剂, 其与β-微管蛋白结合, Kd为0.4μM。Phase 3。				
信号通路	Cytoskeletal Signaling				
靶点	β-tubulin	—	—	—	—
IC50	0.4μM(Kd)	—	—	—	—
体外研究	Combretastatin A4抑制MDA-MB-231、A549、Hela、HL-60、SF295、HCT-8、MDA-MB435、PC3M、OVCAR-8、NCI-H358M和淋巴细胞的生长, IC50分别为2.8、3.8、0.9、2.1、6.2、5.3、7.9、4.7、0.37、8和3.2nM。1μM Combretastatin A4抑制35%微管蛋白聚合, 10μM几乎完全阻断微管蛋白聚合。Combretastatin A4表现出高的相对结合能力, 达到秋水仙碱结合力的78%。				
体内研究	在NT2和MDA-MB-231乳腺肿瘤模型中, Combretastatin A4(100mg/kg, i.p.)诱导脂质R1显著减少, 并通过电子顺磁共振(EPR)血氧定量法测得pO <sub>2</sub> 下降。Combretastatin A4(100mg/kg, i.p.)显著减少雄性NMRI小鼠的K <sub>trans</sub> 。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 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	Colchicine(1.2μM)与微管蛋白(1.3mg/ml)在培养缓冲液(80mM PIPES, 2.0mM MgCl <sub>2</sub> , 0.5mM EGTA, pH 6.9)中于37°C下培养1小时。使用不同浓度(0.1-125μM)的Combretastatin A4与原本结合微管蛋白的colchicine竞争。培育后, 得到滤液。类似物抑制秋水仙碱结合的能力表示为不存在任何竞争物的对照组的百分比。

细胞实验	
细胞系	MDA-MB-231, A549和Hela细胞

浓度	~3.8nM
处理时间	72h
方法	MDA-MB-231, A549和HeLa细胞在DMEM培养基(115units/ml青霉素G, 115µg/ml链霉素和10%胎牛血清)中生长。细胞(5000细胞/孔)接种于包含50µl生长培养基的96孔板, 培养24小时。移除培养基后, 将100µl包含不同浓度单个类似化合物的新鲜培养基加入到每个孔中, 在37°C下培养72小时。培养24小时后, 细胞中增补50µl溶于DMSO(每个制剂中少于0.25%)的类似化合物。培养72小时后, 加入20µl刃天青培养2小时, 然后在560nm(激发波长)和590nm(发射波长)下使用Victor微量滴定板荧光剂记录荧光。对照组为用最大量DMSO (0.25%)处理的细胞, 活性为100%, IC50定义为与对照组相比, 抑制50%细胞增殖的化合物浓度。

动物实验	
动物模型	负荷NT2和MDA-MB-231肿瘤的FVB/N或裸的NMRI雄性小鼠
配制	DMSO
剂量	100mg/kg
给药方式	i.p.

➤ 参考文献:

1. Zheng S, et al. J Med Chem. 2014, 57(8), 3369-3381.
2. Fruytier AC, et al. nMR Biomed. 2014, 27(11), 1403-1412.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC7992-10mM	Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)	10mM×0.2ml
SC7992-5mg	Combretastatin A4 (Microtubule Associated抑制剂)	5mg
SC7992-25mg	Combretastatin A4 (Microtubule Associated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