

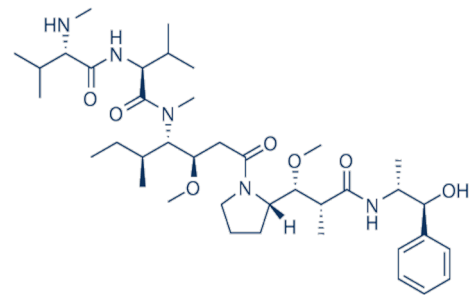
Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1154-10mM	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	10mM×0.2ml
SF1154-5mg	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	5mg
SF1154-25mg	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(2S)-N-[(2S)-1-[[[(3R,4S,5S)-1-[(2S)-2-[(1R,2R)-3-[[[(1S,2R)-1-hydroxy-1-phenylpropan-2-yl]amino]-1-methoxy-2-methyl-3-oxopropyl]pyrrolidin-1-yl]-3-methoxy-5-methyl-1-oxoheptan-4-yl]-methylamino]-3-methyl-1-oxobutan-2-yl]-3-methyl-2-(methylamino)butanamide
简称	Monomethyl auristatin E
别名	MMAE, MMAE peptide, 4Q5
中文名	N/A
化学式	C ₃₉ H ₆₇ N ₅ O ₇
分子量	717.98
CAS号	474645-27-7
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.70ml DMSO, 或每7.18mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF1154-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Monomethyl auristatin E (MMAE)是合成的抗肿瘤药, 其与单克隆抗体(MAB)有关。				
信号通路	Others				
靶点	—	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	耦合到cAC10时, MMAE在CD30+细胞中表现出选择性细胞毒性, 并通过诱导细胞凋亡, 引起G2/M期生长阻滞和细胞死亡。在体外, 与抗-CD79b抗体耦合时, 抗-CD79b-vcMMAE对一大组NHL细胞系具有非常有效且广泛的活性。与抗-HER2抗体耦合时, hertuzumab-vc-MMAE能够被充分吸收, 并有效杀死HER2过表达的肿瘤细胞。				
体内研究	在Karpas 299 ALCL模型中, cAC10-vcMMAE (1mg/kg, i.v.)诱导完全的, 持久的肿瘤退化, 而游离MMAE(0.36mg/kg)不会产生可检测的抗肿瘤活性。在NHL小鼠异种移植模型中, 抗-CD79b-vcMMAE(7mg/kg, p.o.)显著导致持续完全的肿瘤消退。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	CD30+ Karpas 299细胞
浓度	~1000ng/ml
处理时间	96小时
方法	细胞毒性使用Alamar Blue染料还原试验根据制造商指示测量。简而言之, 培养物加入之前, Alamar Blue 40%的溶液(wt/vol)在完全培养基中新鲜制备。药物暴露92小时后, Alamar Blue加入到细胞中, 构

	成10%的培养体积。细胞培养4小时，染料的减少在Fusion HT荧光分析仪(Packard仪器，Meriden，CT)上测量。
--	--

动物实验	
动物模型	负荷Karpas 299 (ALCL)或L540cy (HD)肿瘤的SCID小鼠
配制	N/A
剂量	0.36mg/kg
给药方式	i.v.

➤ **参考文献:**

- 1.Francisco JA, et al. Blood. 2003, 102(4), 1458-1465.
- 2.Dornan D, et al. Blood. 2009, 114(13), 2721-2729.
- 3.Yao X, et al. Breast Cancer Res Treat. 2015, 153(1), 123-133.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF1154-10mM	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	10mM×0.2ml
SF1154-5mg	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	5mg
SF1154-25mg	Monomethyl auristatin E (微管相关抑制剂)	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:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当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