



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **ABT-199 Venetoclax**
CAS 号: **1257044-40-8**
产品货号: **S81268**

生物活性:					
Description	Venetoclax (ABT-199; GDC-0199) 是一种高效, 有选择性和口服有效的 Bcl-2 抑制剂, Ki 小于 0.01 nM。Venetoclax 可以诱导自噬 (autophagy) 作用.				
IC50 & Target[1]	Bcl-2 0.01 nM (Ki)	Bcl-xL 48 nM (Ki)	Bcl-W 245 nM (Ki)		
In Vitro	Venetoclax (ABT-199) 有效杀死 FL5.12-BCL-2 细胞 (EC50=4 nM), Venetoclax (ABT-199) 对 FL5.12-表现出更弱的活性 BCL-XL 细胞 (EC50=261 nM)。ABT-199 在细胞哺乳动物双杂交试验中也表现出选择性, 它会破坏 BCL-2-BIM 复合物 (EC50=3 nM), 但对 BCL-XL 的效果要差得多-BCL-XS (EC50=2.2 μM) 或 MCL-1-NOXA 复合物[1].				
In Vivo	在源自 RS4;11 细胞 (ALL) 的异种移植物模型中, 单次口服剂量为 12.5 mg/kg 后, Venetoclax (ABT-199) 导致最大肿瘤生长抑制 (TGImax=47%) (P<0.001) 和肿瘤生长延迟 (TGD=26%) (P<0.05)[1]。 用 Venetoclax (ABT-199) 100 mg/kg 处理 4 天已建立的异种移植 (T-ALL 细胞系 LOUCY 的小鼠异种移植模型) 肿瘤可显著降低白血病负担[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 77.5 mg/mL (89.24 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) Ethanol 中的溶解度 : < 1 mg/mL (insoluble)				
	Solvent Concentration Preparing Stock Solutions	Mass 1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	1.1515 mL	5.7575 mL	11.5149 mL
		5 mM	0.2303 mL	1.1515 mL	2.3030 mL
		10 mM	0.1151 mL	0.5757 mL	1.1515 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% Ethanol → 60% Phosal 50 PG → 30% PEG400 Solubility: 20 mg/mL (23.03 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂: 5% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: 5 mg/mL (5.76 mM); 悬浊液; Need ultrasonic and warming and heat to 49°C				



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyysw@sina.com

	方案 三 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: 2.5 mg/mL (2.88 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制：将 0.9 g 氯化钠，溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL，可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 四 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (2.88 mM); 悬浊液; 超声加热助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中，混合均匀。 2 g SBE-β-CD（磺丁基醚 β-环糊精）粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比； 如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶。 方案 一 请依序添加每种溶剂： 45% PEG300 → 5% Tween-80 → 50% Saline Solubility: 10 mg/mL (11.51 mM); 悬浊液; 超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂： 15% Cremophor EL → 85% Saline Solubility: 10 mg/mL (11.51 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Souers AJ, et al. ABT-199, a potent and selective BCL-2 inhibitor, achieves antitumor activity while sparing platelets. Nat Med. 2013 Feb;19(2):202-8. [2]. Peirs S, et al. ABT-199 mediated inhibition of BCL-2 as a novel therapeutic strategy in T-cell acute lymphoblastic leukemia. Blood. 2014 Dec 11;124(25):3738-47. [3]. Bi C, et al. Inhibition of 4EBP phosphorylation mediates the cytotoxic effect of mechanistic target of rapamycin kinase inhibitors in aggressive B-cell lymphomas. Haematologica. 2017 Apr;102(4):755-764.

完整储备液配制表：

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限：-80℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	1.1515 mL	5.7575 mL	11.5149 mL	28.7873 mL
	5 mM	0.2303 mL	1.1515 mL	2.3030 mL	5.7575 mL
	10 mM	0.1151 mL	0.5757 mL	1.1515 mL	2.8787 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	15 mM	0.0768 mL	0.3838 mL	0.7677 mL	1.9192 mL
	20 mM	0.0576 mL	0.2879 mL	0.5757 mL	1.4394 mL
	25 mM	0.0461 mL	0.2303 mL	0.4606 mL	1.1515 mL
	30 mM	0.0384 mL	0.1919 mL	0.3838 mL	0.9596 mL
	40 mM	0.0288 mL	0.1439 mL	0.2879 mL	0.7197 mL
	50 mM	0.0230 mL	0.1151 mL	0.2303 mL	0.5757 mL
	60 mM	0.0192 mL	0.0960 mL	0.1919 mL	0.4798 mL
	80 mM	0.0144 mL	0.0720 mL	0.1439 mL	0.3598 mL



源叶