



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: **CBL-0137**
CAS 号: **1197996-80-7**
产品货号: **S88293**

生物活性:

Description	CBL0137 是一种 curaxin 化合物, 是一种组蛋白伴侣促进染色质转录 (FACT) 抑制剂。CBL0137 下调 NF-κ B 并激活 p53。CBL0137 可恢复组蛋白 H3 乙酰化和三甲基化。CBL0137 是一种抗癌剂。CBL0137 诱导癌细胞凋亡 (apoptosis)。				
In Vitro	CBL-0137 浓度高于 2.5 μM 时, 可导致活细胞完全消失。CBL-0137 与 Gemcitabine 联合使用时, 不仅能显著减少 MiaPaCa-2 细胞的集落形成数量, 还能显著减少 Gemcitabine 耐药的 PANC-1 细胞的集落形成数量。CBL-0137 处理人胰腺癌细胞可导致 RRM1 和 RRM2 蛋白及 mRNA 水平呈剂量依赖性降低。CBL-0137 能够阻止 Gemcitabine 诱导的 RRM1 和 RRM2 在 mRNA 和蛋白质水平上的表达[1]。				
In Vivo	CBL-0137 单独处理组和 CBL-0137 与 Gemcitabine 联合治疗组的样本均显示出大面积坏死灶、大量凋亡小体以及肿瘤细胞丢失。亚最佳剂量 (50 至 60 mg/kg) 的 CBL-0137 与最大耐受剂量 (MTD) (90 mg/kg) 相比, 能够增强 Gemcitabine 的抗肿瘤活性, 这体现在联合治疗组之间无统计学显著差异。CBL0137 通过消耗参与转录延伸的活性 FACT 池来抑制 FACT 功能[1]。 CBL-0137 以 30 mg/kg/天的无毒剂量进行灌胃给药, 采用 5 天用药/2 天停药的给药方案, 可抑制结肠癌 (DLD-1)、肾细胞癌 (Caki-1) 和黑色素瘤 (Mel-7) 肿瘤细胞系异种移植瘤以及胰腺导管腺癌患者移植手术标本的肿瘤生长[2]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 11.11 mg/mL (33.02 mM); 超声助溶 (<60°C); 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.9724 mL	14.8619 mL	29.7239 mL
		5 mM	0.5945 mL	2.9724 mL	5.9448 mL
		10 mM	0.2972 mL	1.4862 mL	2.9724 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 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					



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

	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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (7.43 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 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 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Barone TA, et al. Anticancer drug candidate CBL0137, which inhibits histone chaperone FACT, is efficacious in preclinical orthotopic models of temozolomide-responsive and -resistant glioblastoma. <i>Neuro Oncol.</i> 2017 Feb 1;19(2):186-196. h [2]. Burkhardt C, et al. Curaxin CBL0137 eradicates drug resistant cancer stem cells and potentiates efficacy of gemcitabine in preclinical models of pancreatic cancer. <i>Oncotarget.</i> 2014 Nov 30;5(22):11038-53. [3]. Ehteda A, et al. Dual targeting of the epigenome via FACT complex and histone deacetylase is a potent treatment strategy for DIPG. <i>Cell Rep.</i> 2021 Apr 13;35(2):108994.

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° C, 6 months; -20° C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.9724 mL	14.8619 mL	29.7239 mL	74.3097 mL
	5 mM	0.5945 mL	2.9724 mL	5.9448 mL	14.8619 mL
	10 mM	0.2972 mL	1.4862 mL	2.9724 mL	7.4310 mL
	15 mM	0.1982 mL	0.9908 mL	1.9816 mL	4.9540 mL
	20 mM	0.1486 mL	0.7431 mL	1.4862 mL	3.7155 mL
	25 mM	0.1189 mL	0.5945 mL	1.1890 mL	2.9724 mL
	30 mM	0.0991 mL	0.4954 mL	0.9908 mL	2.4770 mL