

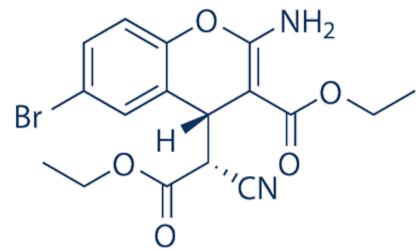
HA14-1 (Bcl-2抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4386-10mM	HA14-1 (Bcl-2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4386-5mg	HA14-1 (Bcl-2抑制剂)	5mg
SC4386-25mg	HA14-1 (Bcl-2抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	ethyl 2-amino-6-bromo-4-(1-cyano-2-ethoxy-2-oxoethyl)-4H-chromene-3-carboxylate
简称	HA14-1
别名	HA 14-1
中文名	N/A
化学式	C ₁₇ H ₁₇ BrN ₂ O ₅
分子量	409.23
CAS号	65673-63-4
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 82mg/ml; Ethanol 82mg/ml
溶液配制	5mg加入1.22ml DMSO, 或每4.09mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4386-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	HA14-1是一种Bcl-2表面口袋的非肽配体, IC ₅₀ 为9μM左右。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	Bcl-2	—	—	—	—
IC ₅₀	9μM	—	—	—	—
体外研究	HA14-1是Bcl-2的小分子非肽配体, 分子量为409, IC ₅₀ 约为9μM。HA14-1通过激活caspase而诱导HL-60细胞凋亡, 这种作用具有剂量依赖性。HA14-1作用于滤泡性淋巴瘤细胞系HF1A3、HF4.9和HF28RA, 具有细胞毒性, LC ₅₀ 分别为4.5μM、12.6μM和8.1μM。HA14-1通过caspase和ROS诱导HF1A3、HF4.9和HF28RA细胞凋亡。				
体内研究	HA14-1(400nM)处理免疫缺陷小鼠, 对胶质母细胞瘤的生没有任何重大影响。但是, HA14-1(400nM)在体内促进DNA损伤剂Etoposide(2.5mg/Kg)对胶质母细胞瘤生长的作用效果。				
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	根据荧光偏振, 通过竞争性结合测定法, 测定在体外有机化合物与Bcl-2蛋白结合的亲和力。实验中, 5-羧基荧光素偶联到肽的N末端, GQVGRQLAIIGDDINR来Bak的BH3结构域(Flu-BakBH3), 高亲和力结合到Bcl-xL蛋白的表面口袋中。根据我们的分子模拟研究和利用荧光偏振进行结合测定, Flu-BakBH3肽结合到Bcl-2的表面口袋具有相似的亲和力。实验中Bcl-2作为重组GST融合的可溶性蛋白。在标准缓冲液环境下, 在有或无有机化合物时, Flu-BakBH3和Bcl-2蛋白混合温育30分钟。使用双路径长度石英池(500μl), 在配备偏振光片的LS-50荧光光谱仪上测量Flu-BakBH3与Bcl-2蛋白的结合力。通过测定不同浓度化合物抑制Flu-BakBH3与Bcl-2结合的能力而测评不同化合物与Bcl-2蛋白的结合亲和力。

细胞实验	
细胞系	HF1A3, HF4.9, HF28RA
浓度	0-25μM
处理时间	20小时
方法	通过MTT法测定HA14-1作用于不同 FL细胞系的毒性。在有或无HA14-1的情况下, 细胞(5000/每孔)按

	一式三份在96孔板中37°C下温育20小时。然后每孔加入MTT溶液。在37°C下温育4小时后，使用96孔板酶标仪测定光密度(OD)。使用以下公式：细胞存活百分数=(实验组OD值/对照组OD值)×100。绘制S型剂量反应曲线，使用Prism 4.0软件计算50%致死浓度值(LC50)。
--	--

动物实验	
动物模型	携带BeGBM移植瘤的雌性Swiss裸鼠
配制	HA14-1在100µl free RPMI 1640-50% DMSO中配制
剂量	400nM
给药方式	在细胞注射位点注射

➤ **参考文献:**

- 1.Wang JL, et al. Proc Natl Acad Sci, 2000, 97(13), 7124-7129.
- 2.Skommer J, et al. Leuk Res, 2006, 30(3), 322-331.
- 3.Manero F, et al. Cancer Res, 2006, 66(5), 2757-2764.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC4386-10mM	HA14-1 (Bcl-2抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4386-5mg	HA14-1 (Bcl-2抑制剂)	5mg
SC4386-25mg	HA14-1 (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