

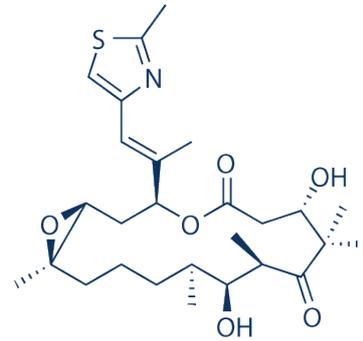
## Epothilone B (Microtubule Associated抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0164-10mM	Epothilone B (Microtubule Associated抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0164-5mg	Epothilone B (Microtubule Associated抑制剂)	5mg
SC0164-25mg	Epothilone B (Microtubule Associated抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(1S,3S,7S,10R,11S,12S,16R)-7,11-dihydroxy-8,8,10,12,16-pentamethyl-3-[(E)-1-(2-methyl-1,3-thiazol-4-yl)prop-1-en-2-yl]-4,17-dioxabicyclo[14.1.0]heptadecane-5,9-dione
简称	Epothilone B
别名	EPO906, Patupilone, Epothilon B, 帕士匹龙
中文名	埃博霉素B
化学式	C <sub>27</sub> H <sub>41</sub> NO <sub>6</sub> S
分子量	507.68
CAS号	152044-54-7
纯度	99.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 102mg/ml; Ethanol 102mg/ml
溶液配制	5mg加入0.98ml DMSO, 或每5.08mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0164-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Epothilone B(EPO906, Patupilone)是一种紫杉醇样microtubule稳定剂, EC0.01为1.8μM。Phase 2。				
信号通路	Cytoskeletal Signaling				
靶点	Tubulin	-	-	-	-
IC50	1.8μM(EC0.01)	-	-	-	-
体外研究	Epothilone B比Epothilone A活性高。Epothilone B的EC0.01为1.8nM。Epothilone B作用于HCT116细胞, 有效抑制细胞增殖, IC50为0.8nM。Epothilone B作用于KB3-1、KBV-1、Hela和Hs578T细胞, 诱导细胞周期停顿, 且具有细胞毒性, IC50为3nM到92nM。Epothilone B与紫杉醇竞争性与微管结合, IC50为3.3μM。3.5nM Epothilone B作用于过量表达GFP-α-微管蛋白的MCF-7细胞, 充分抑制微管动力学。同时, Epothilone B诱导有丝分裂停滞, IC50为3.5nM。Epothilone B作用于多发性骨髓瘤(MM)细胞, 包括RPMI 8226、U266、MM.1S、LR5和MR20, 直接抑制细胞增殖, IC50为1nM到10nM。10nM Epothilone B也诱导细胞周期停滞和细胞凋亡。最新研究显示, 5nM-100nM Epothilone B作用于卵巢癌Hey细胞, 增强表面上皮细胞粘附抗原(EpCAM)。				
体内研究	Epothilone B按2.5mg/kg-4mg/kg剂量作用于携带RPMI 8226细胞移植瘤的小鼠, 延长小鼠寿命且抑制肿瘤生长。Epothilone B作用于携带前列腺癌细胞, 包括DU145和PC3的移植瘤小鼠, 也抑制肿瘤生长。				
临床实验	N/A				
特征	Epothilone B是类似紫杉醇的抗癌常规化合物, 诱导微管蛋白聚合。				

#### ➤ 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	纯化牛脑微管蛋白(MTP), 包含约15%-20%微管相关蛋白。用于Epothilone B-微管研究的buffer(MES buffer)含0.1M 2-吗啉乙磺酸(MES)、1mM EGTA、0.5mM MgCl <sub>2</sub> 和3M甘油, pH为6.6。电子显微镜观察的样本置于碳覆盖火棉胶片包被的网格上(300个网孔), 用2%乙酸铀酰进行负染色。在有或无Epothilone B存在时, 使用分光光度计和恒温调节液体循环器。检测微管装配。温度维持在35°C, 350nm处检测到变浑浊状态(代表聚合物规模)。计算EC0.01。

细胞实验	
细胞系	KB3-1、KBV-1、Hela和Hs578T细胞
浓度	0-1 $\mu$ M
处理时间	24小时测定有丝分裂停顿，72小时测定细胞毒性。
方法	为了测定有丝分裂受阻和畸变，细胞接种在48孔板中(用台酚蓝染色，测定细胞数)或置于盖玻片上。24小时后，用Epothilone B处理细胞，在固定时间间隔记录。为了分析毒性，测定细胞数，用台酚蓝染色记录阳性和阴性。同时，盖玻片和培养基上清液中等分的细胞混合，用溶于PBS的Hoechst 33342染色。在有丝分裂受阻(停在G2-M期)和畸变的时候记录细胞。

动物实验	
动物模型	携带RPMI 8226细胞移植瘤的小鼠
配制	溶于30% PEG-300
剂量	2.5mg/kg-4mg/kg
给药方式	静脉注射

#### 参考文献:

1. Swindell CS, et al. J Med Chem. 1991; 34(3):1176-1184.
2. Bollag DM, et al. Cancer Res. 1995; 55(11):2325-2333.
3. Regueiro-Ren A, et al. Org Lett. 2001; 3(17):2693-2696.
4. Kamath K, et al. Cancer Res. 2003; 63(18):6026-6031.
5. Lin B, et al. Blood. 2005; 105(1):350-357.
6. O'Reilly T, et al. Prostate. 2005; 65(3):231-240.
7. Shahabi S, et al. Gynecol Oncol. 2010; 119(2):345-350.

#### 包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0164-10mM	Epothilone B (Microtubule Assosiated抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC0164-5mg	Epothilone B (Microtubule Assosiated抑制剂)	5mg
SC0164-25mg	Epothilone B (Microtubule Assosiated抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

#### 保存条件:

-20 $^{\circ}$ 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 $^{\circ}$ 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降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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其它相关文献，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 2017.02.09