

## (R)-(-)-Gossypol acetic acid

### 产品信息

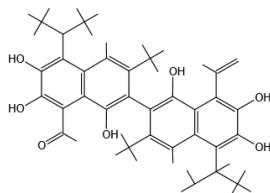
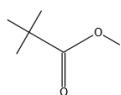
产品名称	产品编号	规格
(R)-(-)-Gossypol acetic acid	53729ES08	5 mg
	53729ES25	25 mg

### 产品描述

(R)-(-)-Gossypol acetic acid (AT-101 (acetic acid); (-)-Gossypol acetic acid; (R)-Gossypol acetic acid), 又称(R)-(-)-醋酸棉酚，是醋酸棉酚的 R-(-)对映体，能结合到 Bcl-2、Mcl-1 和 Bcl-xL 蛋白，诱导细胞凋亡，具有潜在抗癌活性。

### 产品性质

英文别名 (English Synonym)	(R)-(-)-Gossypol acetic acid, AT-101 (acetic acid); (-)-Gossypol acetic acid; (R)-Gossypol acetic acid
中文名称 (Chinese Name)	(R)-(-)-醋酸棉酚
靶点 (Target)	Bcl-2, Mcl-1, Bcl-xL
通路 (Pathway)	Apoptosis--Bcl-2 Family
CAS 号 (CAS NO.)	866541-93-7
分子式 (Formula)	C <sub>32</sub> H <sub>34</sub> O <sub>10</sub>
分子量 (Molecular Weight)	578.61
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO



### 运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C，有效期 3 年。建议分装后-20°C 干燥保存，避免反复冻融。

### 注意事项

- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

### 使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

## 使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

### （一）细胞实验（体外实验）

AT-101 (10  $\mu$ M)作用于弥漫性大 B 细胞和套细胞淋巴瘤细胞系，破坏线粒体膜电位( $\Delta\psi_m$ )，这种作用存在浓度和时间依赖性。AT-101 (1 or 2  $\mu$ M)与 Carfilzomib (6 or 10 nM)联用作用于 HBL-2 和 Granta 细胞系，诱导细胞凋亡。<sup>[1]</sup> AT-101(20  $\mu$ M )处理悬浮培养和基质细胞共培养的 CLL 淋巴细胞 24 h，导致 72% 细胞凋亡，且下调 Mcl-1。<sup>[2]</sup> AT-101 作用于 Jurkat T 和 U937 细胞，诱导凋亡，ED<sub>50</sub> 值分别为 1.9 mM 和 2.4 mM，这种作用具有时间和剂量依赖性。AT-101(10  $\mu$ M)与辐射(32 Gy)联合治疗与只使用辐射相比，诱导更多细胞凋亡，且治疗效果超过单剂治疗引起的效果总和。<sup>[3]</sup> AT-101(10  $\mu$ M)作用于 VCaP 细胞，通过激活 caspase-9、-3 和 -7 诱导凋亡。AT-101 (10  $\mu$ M)作用于 VCaP 细胞，降低 Bcl-2 和 Mcl-1 表达。<sup>[4]</sup>

### （二）动物实验（体内实验）

在 VCaP 移植瘤小鼠模型中，口服 AT-101 (15 mg/kg)显著抑制瘤体生长；AT-101 与外科阉割联合处理小鼠，与只阉割处理或只使用 AT-101 处理组相比，延迟激素非依赖性的 VCaP 肿瘤生长发病情况。<sup>[4]</sup>

## 参考文献

- [1]. Wang G, et al. Structure-based design of potent small-molecule inhibitors of anti-apoptotic Bcl-2 proteins. *J Med Chem.* 2006 Oct 19;49(21):6139-42.
- [2]. Paoluzzi L, et al. Targeting Bcl-2 family members with the BH3 mimetic AT-101 markedly enhances the therapeutic effects of chemotherapeutic agents in vitro and in vivo models of B-cell lymphoma. *Blood.* 2008 Jun 1;111(11):5350-8.
- [3]. Balakrishnan K, et al. AT-101 induces apoptosis in CLL B cells and overcomes stromal cell-mediated Mcl-1 induction and drug resistance. *Blood.* 2009 Jan 1;113(1):149-53.
- [4]. Zerp SF, et al. AT-101, a small molecule inhibitor of anti-apoptotic Bcl-2 family members, activates the SAPK/JNK pathway and enhances radiation-induced apoptosis. *Radiat Oncol.* 2009 Oct 23;4:47.