

帕唑帕尼 ; Pazopanib

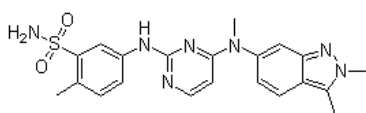
产品编号 : MB1299

质量标准 : ≥99%

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : 白色或类白色结晶性粉末

基本信息

| | | | |
|------------|--|-----|---|
| 分子式 | C21H23N7O2S | 结构式 |  |
| 分子量 | 437.52 | | |
| CAS No. | 444731-52-6 | | |
| 储存条件 | -20°C, 避光防潮密闭干燥 | | |
| 溶解性 (25°C) | DMSO : 87 mg/mL warmed (198.84 mM) Water : Insoluble Ethanol : Insoluble | | |
| 注意事项 | 溶解性是在室温下测定的, 如果温度过低, 可能会影响其溶解性。 | | |
| 其他说明 | 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。 | | |

简介: 帕唑帕尼 Pazopanib 是一种有效的多靶点抑制剂, 作用于 VEGFR1, VEGFR2, VEGFR3, PDGFR β , c-Kit, FGFR1 和 c-Fms, IC50 分别为 10, 30, 47, 84, 74, 140 和 146 nM。

物理性状及指标 :

外观 :白色或类白色结晶性粉末

溶解性 :DMSO : 87 mg/mL warmed (198.84 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

干燥失重 :≤1.0%

含量 :≥99%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

生物活性

| | | | | | |
|-------------|---|-----------------------------|-----------------------------|----------------------------|----------------------------|
| 产品描述 | Pazopanib 是一种新型多靶点的 VEGFR1, VEGFR2, VEGFR3, PDGFR, FGFR, c-Kit 和 c-Fms 抑制剂, 无细胞试验中 IC50 分别为 10 nM, 30 nM, 47 nM, 84 nM, 74 nM, 140 nM 和 146 nM。 | | | | |
| 靶点 | VEGFR1 (Cell-free assay) | VEGFR2 (Cell-free assay) | VEGFR3 (Cell-free assay) | c-Kit (Cell-free assay) | PDGFR (Cell-free assay) |
| | 10 nM | 30 nM | 47 nM | 74 nM | 84 nM |
| 体外研究 | Pazopanib 有效抑制 VEGF 诱导的 HUVEC 细胞中 VEGFR2 磷酸化作用, IC50 为 8 nM。在所有滑膜肉瘤细胞系, 包括 SYO-1 和 HS-SY-II 细胞中, Pazopanib 表现出剂量依赖性生长抑制作用。SYO-1 和 HS-SY-II 细胞的增殖在 1 微克/毫升的 Pazopanib 下被抑制, 在 5 微克/毫升的 Pazopanib 下被完全废止。Pazopanib 引起 G1 期阻滞, 并且因此抑制滑膜肉瘤细胞的生长。与载体处理的细胞相比, Akts, GSK-3 β , JNKs, p70 S6 激酶, 和 mTOR 的磷酸化作用在 Pazopanib 处理的 SYO-1 细胞中被抑制。Pazopanib 在 20 毫克/毫升和 22.5 毫克/毫升之间表现出逐渐增加的 RPE 细胞活性降低。 | | | | |

| | |
|-------------|---|
| 体内研究 | 与用载体或 10 毫克/千克 Pazopanib 处理的小鼠相比，用 30 毫克/千克或 100 毫克/千克 Pazopanib 处理的小鼠，肿瘤负荷显著降低。Pazopanib 治疗具有良好的耐受性，并且每组小鼠的体重差异没有明显不同。 |
|-------------|---|

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。帕唑帕尼是一种 VEGFR 的酪氨酸激酶抑制剂，通过选择性抑制 VEGFR-1，VEGFR-2，VEGFR-3，与 ATP 竞争性结合胞外的配体结合位点，阻断分子内酪氨酸的自身磷酸化，抑制 VEGFR 激活，从而加速细胞凋亡，抑制血管生成，抑制肿瘤浸润和转移。在体外实验中，帕唑帕尼能有效地抑制小鼠肺的血管内皮生长因子诱导的 VEGFR 磷酸化以及血管生成。帕唑帕尼同时还特异性作用于血小板衍生生长因子受体(PDGFR) - α 和 PDGFR - β ，成纤维细胞生长因子受体(FG-FR) -1 和-3，干细胞因子受体(K it)，受体诱导 T 细胞激酶(Itk)，白细胞特异性蛋白酪氨酸激酶(Lck)，以及跨膜糖蛋白受体酪氨酸激酶(c-Fm s)。

储液配置

| 体 浓度 | 质 量 积 | | |
|---------|-------------|------------|------------|
| | 1 mg | 5 mg | 10 mg |
| 1 mM | 2.2856 mL | 11.4280 mL | 22.8561 mL |
| 5 mM | 0.4571 mL | 2.2856 mL | 4.5712 mL |
| 10 mM | 0.2286 mL | 1.1428 mL | 2.2856 mL |
| 50 mM | 0.0457 mL | 0.2286 mL | 0.4571 mL |

经典实验操作（仅供参考）

| | |
|--------------|---|
| 动物实验： | Animal Models: 含有 SYO-1 细胞的免疫缺陷小鼠 Formulation: -- Dosages: 0 毫克/千克, 10 毫克/千克, 30 毫克/千克, 或 100 毫克/千克 Administration: 口服给药 |
|--------------|---|

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 <0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 <5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

| 物种 | 体重(KG) | 体表面积(M2) | Km 系数 |
|----|--------|----------|-------|
| 狒狒 | 12 | 0.6 | 20 |
| 狗 | 10 | 0.5 | 20 |
| 猴 | 3 | 0.24 | 12 |
| 兔 | 1.8 | 0.15 | 12 |
| 豚鼠 | 0.4 | 0.05 | 8 |
| 大鼠 | 0.15 | 0.025 | 6 |
| 仓鼠 | 0.08 | 0.02 | 5 |
| 小鼠 | 0.02 | 0.007 | 3 |

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

| 标示重量范围 | 误差范围 |
|----------|-------|
| 1-20MG | 0.1MG |
| 50-500MG | 1MG |
| >1G | 3-5MG |

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。