

Pazopanib HCl ; 帕唑帕尼盐酸盐

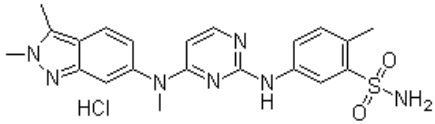
产品编号 : MB1679

质量标准 : >99%,BR,可用于细胞培养

包装规格 : 20MG;100MG;1G

产品形式 : 类白色粉末

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₃ N ₇ O ₂ S.HCl	结 构 式	
分子量	473.98		
CAS No.	635702-64-6		
储存条件	常温, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 17 mg/mL (35.86 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 盐酸帕唑帕尼 Pazopanib Hydrochloride(GW-786034 盐酸盐是多靶点抑制剂, 对 VEGFR1 ,VEGFR2 , VEGFR3 , PDGFR , FGFR , c-Kit 和 c-Fms 的 IC₅₀ 分别为 10 nM , 30 nM , 47 nM , 84 nM , 74 nM , 140 nM 和 146 nM。

别名 : 盐酸帕唑帕尼 ; 帕唑帕尼盐酸盐 ; Votrient; Armala; GW 786034; GW-786034;Pazopanib hydrochloride ; Pazopanib HCl

物理性状及指标 :

外观 :类白色粉末

溶解性 :DMSO : 17 mg/mL (35.86 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量 :>99%

储存条件 : 常温, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	Pazopanib HCl (GW786034 HCl)是一种新型多靶点抑制剂, 作用于 VEGFR1 , VEGFR2 , VEGFR3 , PDGFR , FGFR , c-Kit 和 c-fms , 在无细胞试验中 IC ₅₀ 分别是 10 nM , 30 nM , 47 nM , 84 nM , 74 nM , 140 nM 和 146 nM。				
特性	Pazopanib 是一个多激酶的抑制剂。				
靶点	VEGFR1 (Cell-free assay)	VEGFR2 (Cell-free assay)	VEGFR3 (Cell-free assay)	FGFR (Cell-free assay)	PDGFR (Cell-free assay)
	10 nM	30 nM	47 nM	74 nM	84 nM
体外研究	在 HUVEC 细胞中, Pazopanib 显著抑制 VEGF 诱导的 VEGFR-2 的磷酸化, IC ₅₀ 为 8nM。在所有滑膜肉瘤细胞系中 Pazopanib 都表现出了生长抑制作用, 包括 SYO-1 和 HS-SY-II 细胞, 这种抑制具有剂量依赖的特性。1μg/mL Pazopanib 就可以抑制 SYO-1 和 HS-SY-II 细				

	胞增殖，而 5 μ g/mL Pazopanib 可以让它们的增殖彻底受阻。Pazopanib 会诱导滑膜肉瘤细胞周期停留在 G1 期从而抑制它的生长。与对照的细胞相比，经过 Pazopanib 处理过的 SYO-1 细胞中的 AKTs, GSK-3 β , JNKs, p70 S6 激酶以及 mTOR 的磷酸化都受到了抑制。在 20 mg/mL 到 22.5 mg/mL 的浓度之间，Pazopanib 使 RPE 细胞的生存能力逐渐下降。
体内研究	与没有经过 Pazopanib 或者仅用 10 mg/kg 的 Pazopanib 治疗的小鼠相比 经过 30 mg/kg 或者 100 mg/kg Pazopanib 治疗的小鼠其肿瘤症状明显减轻。Pazopanib 治疗耐受性良好，[各组小鼠之间体重没有发生明显差异]。

美仑相关产品推荐

MB1299	帕唑帕尼
--------	------

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	2.1098 mL	10.5490 mL	21.0979 mL
5 mM	0.4220 mL	2.1098 mL	4.2196 mL
10 mM	0.2110 mL	1.0549 mL	2.1098 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>激酶活性测定:</p> <p>通过杆状病毒表达系统纯化人源的 VEGFR 受体激酶 1, 2 和 3 的 C 端催化活性区域的 GST 融合蛋白，用这些蛋白在 384 孔微量滴定板上利用均相时间分辨荧光技术 (HTRF) 对 VEGFR1,2 和 3 的酶活性进行分析。首先将 10 μL 活化的 VEGFR2 激酶溶液 [终浓度为 1nM 酶溶于 0.1 M HEPES, pH 7.5, 包含 0.1 mg/mL BSA, 300 μM DTT] 加入 10 μL 底物溶液 [终浓度为 360 nM 多肽 (生物素偶联的 aminoethyl-EEEEYFELVAKKKK-NH₂) , 75 μM ATP, 10 μM MgCl₂]，同时加入 1 μL 溶解在 DMSO 中的 Pazopanib。滴定板在室温条件下孵育 1 小时 然后加入 20 μL 100 mM 的 EDTA 终止反应。终止之后，加入 20 μL HTRF 试剂 (终浓度为 15 nM 链亲和素偶联的别藻蓝素，用 0.1 mg/mL BSA, 0.1 M HEPES, pH 7.5 稀释的 1 nM 铕标记的酪氨酸磷酸化抗体) 孵育十分钟以上。使用 Wallac Victor 的时间分辨荧光仪测定 665 nm 处的荧光值，时间间隔为 50 μs。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HUVEC 细胞</p> <p>Concentrations: 0 μM -10 μM</p> <p>Incubation Time: 1 小时</p> <p>Method:</p> <p>检测经过 VEGF 处理过的 HUVEC 细胞中 VEGFR2 的磷酸化水平。细胞按每板 100 万到 150 万个</p>

	的密度培养在铺有 I 型胶原蛋白的 10 cm 平板上, 培养基选用 Clonetics EGM-MV。培养 24 小时后, 将原来的培养基换成含有 0.1% BSA 和 500 µg/mL hydrocortisone 的 Clonetics EBM 培养基, 对细胞进行过夜的血清饥饿处理。然后用不同浓度的 Pazopanib 处理细胞 1 小时, 随后用 10 ng/mL 的 VEGF 或者对照物处理细胞 10 分钟。将细胞溶解在裂解液中。用 flk-1 的抗体对 VEGFR2 进行免疫沉淀反应, 随后进行 SDS-聚丙烯酰胺凝胶电泳, 然后用 flk-1 或者 antiphosphotyrosine (anti-P-tyr-biotin)的抗体进行蛋白免疫印迹的检测。通过光密度法测量将 VEGFR2 的磷酸化水平量化并将总的 VEGFR2 水品标准化。
动物实验	Animal Models: 携带 SYO-1 细胞的免疫缺陷小鼠 Formulation: -- Dosages: 0 mg/kg, 10 mg/kg, 30 mg/kg 或 100 mg/kg Administration: 口服

【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。