

PA-824

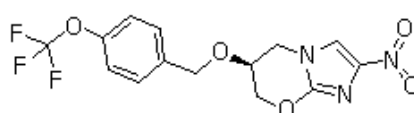
产品编号：MB3479

质量标准：>98%,BR

包装规格：10MG;50MG

产品形式：powder

基本信息

分子式	C14H12F3N3O5	结构式	
分子量	359.26		
CAS No.	187235-37-6		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 72 mg/mL (200.41 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 16 mg/mL (44.53 mM)		
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：PA-824(Pretomanid)可作用于肺结核，MIC 为<1 µg/mL。

别名：(S)-PA 824, PA 824, Pretomanid ;

(6S)-6,7-Dihydro-2-nitro-6-[[4-(trifluoromethoxy)phenyl]methoxy]-5H-Imidazo[2,1-b][1,3]oxazine

物理性状及指标：

外观：.....白色至棕色粉末

溶解性：.....DMSO : 72 mg/mL (200.41 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 16 mg/mL (44.53 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PA-824 是一种抗肺结核药，作用于 tuberculosis，MIC 为<1 µg/mL。
特性	实验性抗结核药。
靶点	tuberculosis
体外研究	在体外，PA-824 对来自亚洲(印度和韩国) 和全美国(MIC < 1 µg/ml)的多药耐药临床菌株表现出高活性，并且对药物敏感性和多药耐药性结核杆菌菌株同样有效(MICs 范围，0.039 到 0.531 µg/ml)。一项最近的研究表明 PA-824 耐药基因(fgd1 [Rv0407]和 ddn [Rv3547])的单核苷酸多态性对 PA-824 MICs (≤ 0.25 µg/ml)无显著影响。
体内研究	在急性肺结核小鼠模型中,PA-824 表现出显著的剂量依赖性抗肿瘤活性 溶于 MC 的 PA-824 50 mg/kg 使肺中 CFU 产生超过 1-log 的减少 ;100 mg/kg 产生 2-log 的减少 ;300 mg/kg 产生 3-log 的减少。此外，PA-824(100 mg/kg)在环糊精/卵磷脂中长期治疗导致细菌负荷量减少，在肺和脾中低于 500 CFU。在肺结核小鼠模型中，PA-824 表现出时间依赖性抗菌活性，24 天中观察到的最大杀菌作用为 0.1 log CFU/天。

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。PA-824 是一种对复制和非复制结核分枝杆菌都有作用的前药。它被 deazaflavin(辅因子 F420)依赖硝基还原酶激活。PA-824 是一种

抗结核药物，具有多种作用机制，包括细胞壁抑制和呼吸中毒。

储液配置

体 积 浓度	质 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM		2.7835 mL	13.9175 mL	27.8350 mL
5 mM		0.5567 mL	2.7835 mL	5.5670 mL
10 mM		0.2783 mL	1.3917 mL	2.7835 mL
50 mM		0.0557 mL	0.2783 mL	0.5567 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验：	<p>Cell lines: 结核分枝杆菌 H37Rv</p> <p>Concentrations: 2.0 µg/mL - 8.0 pg/mL</p> <p>Incubation Time: 21 天</p> <p>Method: 一种用于测定 MICs 的方法通过微量稀释平板法使用结核分枝杆菌 H37Rv 进行。INH 以 500 µg/ml 的原浓度溶解于无菌的双蒸馏水中。PA-824 溶解于 100%二甲基亚砜 (DMSO)，原浓度为 100 µg/ml。两种化合物的一系列 1:2 稀释物在单独的 96 微孔板中使用相同稀释剂制备。96 孔圆底微量滴定测定板内部的 60 孔接种 98 µl 细菌悬浮液。将 2µl 每种药物转移到包含细菌的测试板。INH 在孔中的终浓度范围为 10.0 到 0.039 µg/mL ;PA-824 的终浓度范围为 2.0 µg/mL 到 8.0 pg/mL。测试板在 37 °C 下至少培养 21 天，然后观察 3 到 4 天以评估生长的改变。生长的抑制通过肉眼检查和分光光度计在 OD600 下测定。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: γ 干扰素基因被破坏的(GKO)小鼠 ,通过小剂量气雾剂暴露于结核分枝杆菌 Erdman 被感染。</p> <p>Formulation: PA-824 溶于 0.5%甲基纤维素(MC)或环糊精/卵磷脂(CM2)中。</p> <p>Dosages: ≤300 mg/kg</p> <p>Administration: 口服给药</p>

【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。