

## Palomid529 (P529)

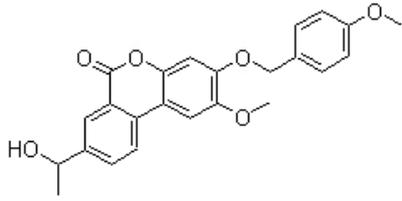
产品编号：MB3892

质量标准：>98%，抑制 mTORC1 和 mTORC2 复合体

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

### 基本信息

分子式	C24H22O6	结 构 式	
分子量	406.43		
CAS No.	914913-88-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO：81 mg/mL (199.29 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：**Palomid 529 是一种有效的 mTORC1 和 mTORC2 复合体抑制剂。

**别名：**Palomid529；P529；6H-Dibenzo[b,d]pyran-6-one,

8-(1-hydroxyethyl)-2-methoxy-3-[(4-methoxyphenyl)methoxy]-

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO：81 mg/mL (199.29 mM)；Water Insoluble；Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：**-20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Palomid 529 抑制 mTORC1 和 mTORC2 复合体,降低 pAktS473, pGSK3βS9,和 pS6 磷酸化,但是对 pMAPK 和 pAktT308 没有作用效果。	
<b>靶点</b>	mTORC1	mTORC2
<b>体外研究</b>	Palomid 529 抑制内皮细胞增殖并增加细胞凋亡。Palomid 529 抑制 VEGF-介导和 bFGF 介导的内皮细胞增殖, IC 50 分别为 20 nM 和 30 nM。Palomid 529 可诱导内皮细胞凋亡,降低血管内皮生长因子 VEGF-A 驱动的 pAktS473, pGSK3βS9 和 pS6 磷酸化。然而, Palomid 529 并不像有效降低 pAktS473 磷酸化一样抑制丝裂原活化蛋白激酶( pMAPK )磷酸化或 pAktT308 磷酸化。Palomid529 不仅降低缺血性视网膜的增殖,也提高血管形成的组织和结构。[1] Palomid 529 在肺癌 NCI- 60 细胞系中显示高效的抗增殖活性, GI50< 35μM。此外, Palomid 529 在前列腺癌细胞 PC-3 显著加剧辐射引起的抗增殖作用。该生长抑制作用呈浓度依赖性。剂量为 2 和 7μM 可分别导致 30 和 60%的生长抑制。Palomid 529 在 PC-3 中抑制辐射诱导 p-Akt 激活和减少 Bcl-2/Bax 比例。Palomid 529 不仅抑制辐射的 Id-1 和 VEGF 过表达也下调辐射诱导 MMP - 2 和 MMP - 9	
<b>体内研究</b>	Palomid 529 剂量依赖性抑制 Ad-VEGF-A 驱动的血管生成, 裸鼠灌胃后 Palomid 529 可抑制	

	C6V10 胶质瘤生长。Palomid 529 作用于 AktS473 而非 AktT308 信号。Palomid 529 抑制肿瘤生长，血管生成和血管通透性。与对照组相比，Palomid 529 处理 PC - 3 肿瘤小鼠可减少 57.1% 的肿瘤的生长。Palomid 529 可有效抑制 Müller 细胞增殖，神经胶质瘢痕形成，和在兔视网膜脱离 ( RD ) 模型中的感光细胞死亡。在小鼠 Brca1 缺失肿瘤生长模型中，Palomid 529 显著抑制 Akt 和 mTOR 信号通路。
<b>特征</b>	Palomid 529 是一种新颖的非类固醇类小分子抑制剂

**美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)**

MB3869	GSK2126458 (GSK458)
MB3467	Torin 1

**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。Palomid 529 是一种有效的 mTORC1 和 mTORC2 复合体抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**

浓度	体 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.4604 mL	12.3022 mL	24.6045 mL
5 mM	0.4921 mL	2.4604 mL	4.9209 mL
10 mM	0.2460 mL	1.2302 mL	2.4604 mL
50 mM	0.0492 mL	0.2460 mL	0.4921 mL

**经典实验操作 ( 仅供参考 )**

<b>激酶实验：</b>	<p><b>雌激素受体结合实验：</b></p> <p>利用 TNT 系统兔网织红细胞获得蛋白。根据经验确定每一个反应中模板用量和用 <math>[^{35}\text{S}]</math> 标记重组蛋白用凝胶电泳和显影检测蛋白表达。在 100mL 终体积 TEG 缓冲 [ 10 mM Tris (pH 7.5), 1.5 mM EDTA, 10% 甘油 ] 中进行雌激素受体 ( ER ) 和 Palomid 529 结合反应。每个结合反应中使用体外转录-翻译受体 ( 5<math>\mu\text{L}</math> ) 和 0.5 nM <math>[^3\text{H}]</math> 雌二醇 ( E2 )。Palomid 529 检测浓度一般 <math>10^{-11}</math> 到 <math>10^{-6}</math> M 用乙醇稀释。4<math>^{\circ}\text{C}</math> 培养过夜，加入 200mL 葡聚糖包裹木炭检测 E 2 结合量。4<math>^{\circ}\text{C}</math> 摇床孵育 15 分钟，离心 10 分钟。150mL 上清液加入到 5mL 闪烁混合物测定液中用于闪烁计数法。将只含乙醇 E2 的实验对照组读值设为最大结合值。背景组为 5mL 未表达 E2 的兔网织红细胞裂解液。背景值通常为最大结合值的 10% 到 15%，将在所有测试值中扣除。利用检测值绘制曲线和测定 <math>K_i</math> 值。每个实验包含三次重复。</p>
<b>细胞实验：</b>	<p><b>Cell lines:</b> 人脐静脉血管内皮细胞 ( HUVEC )</p> <p><b>Concentrations:</b> 0 <math>\mu\text{M}</math> - 20 <math>\mu\text{M}</math></p> <p><b>Incubation Time:</b> 48 小时</p> <p><b>Method:</b> 本增殖实验使用人脐静脉血管内皮细胞 ( HUVEC )。进行内皮细胞在 96 孔板中按 1000 个细胞每孔密度铺板，在完全培养基中培养。铺板后 24 小时，细胞用含 0.5% 血清饥饿培养 24 小时，后续将 Palomid 529 溶于含 10 ng/mL bFGF 或 VEGF 的完全培养基，继续培养细胞 48 小时。利用比色法计量细胞数量。结果显示 Palomid 529 未处理的细胞具有最大 bFGF 或 VEGF 响应值。用 Palomid 529 处理 96 孔板中内皮细胞 48 小时可抑制内皮细胞增殖。最初，每 5000 细胞铺板可在第二天达到细胞汇合。细胞板孵育又 24 个小时以保证细胞已生长阻滞，再用 Palomid 529 处理。</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。如需制备储备液，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。