

PP-2 ; PP2

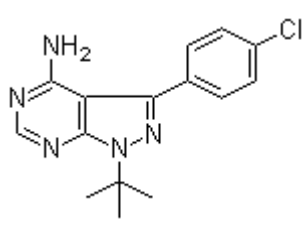
产品编号 : MB3960

质量标准 : >98% , Src 家族激酶抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C15H16ClN5	结 构 式	
分子量	301.77		
CAS No.	172889-27-9		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 60 mg/mL (198.82 mM) Water Insoluble Ethanol : 2 mg/mL (6.62 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 : PP2 是可逆, ATP 竞争性的 Src 家族抑制剂, 抑制 Lck 和 Fyn。

别名 : AGL 1879 ; 1H-Pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-amine, 3-(4-chlorophenyl)-1-(1,1-dimethylethyl)-

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 60 mg/mL (198.82 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 2 mg/mL (6.62 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	PP2 是 Src 家族激酶抑制剂, 有效抑制 Lck/Fyn , IC50 为 4 nM/5 nM,作用于 EGFR 效果低 100 倍左右,抑制 ZAP-70, JAK2 和 PKA 活性。	
靶点	LCK	Fyn
IC50	4 nM	5 nM

体外研究	<p>PP2(5 μM)作用于 NIH3T3 和 NIH-RET/PTC3 细胞裂解液,抑制体内 RET/PTC1 肿瘤蛋白的磷酸化和信号。PP2(5 μM)作用于转化 RET/PTC1 的 NIH3T3 成纤维细胞,和携带自发性 RET/PTC1 重排的两钟人类甲状腺乳头状癌细胞系 TPC1 和 FB2,抑制血清非依赖性的生长。PP2 (5 μM) 抑制 TPC1 细胞 I 型胶原基质入侵。PP2 通过结合到分子的与 ATP 结合结构域不重叠的某一区域,而抑制 Src。PP2(20 μM)抑制 40-50% HT29 细胞生长,处理 1 小时,该浓度降低 Src 活性,并维持抑制 35%Src 活性达 2 天。</p> <p>PP2(100 mM)作用于 HT29 细胞,降低 Src 活性,这种作用具有剂量依赖性。PP2(1 mM-100 mM) 抑制人类结肠癌细胞(HT29, SW480, 和 PMCO1),肝癌细胞(PLC/PRF/5, KYN-2, Li7, 和 HepG2), 和乳腺癌细胞(MCF-7, MDA-MB-468,和 BT-474)生长,这种作用具有剂量依赖性。PP2(20 μM)显著促进大部分癌细胞(HT29, SW480, PMCO1, PLC/PRF/5, KYN-2, Li7, MCF-7, 和 MDA-MB-468)聚合,这种作用具有 E-钙粘蛋白依赖性。PP2(20 μM)作用于癌细胞,增强 E-钙粘蛋白表达,且强促进 E-钙粘蛋白与肌动蛋白细胞骨架的关联。PP2(20 μM)作用于 HT29 细胞,增强α-catenin, β-catenin, 和 γ-catenin 表达,而作用于 PLC/PRF/5 和 MCF-7 细胞,α-catenin 的总蛋白水平没有改变,但β-catenin 和 γ-catenin 水平稍微增长。PP2 抑制两种宫颈癌细胞 (HeLa 和 SiHa)增殖,这种作用具有时间和剂量依赖性。PP2(10 μM) 作用于 HeLa 和 SiHa 细胞,下调 pSrc-Y416, pEGFR-Y845, 和-Y1173 表达水平。PP2(10 μM) 通过上调 HeLa 和 SiHa 细胞的 p21(Cip1) 和 p27(Kip1), 及下调 HeLa 细胞的 cyclin A 和细胞周期蛋白依赖性激酶-2,-4 (Cdk-2,-4)的表达,和下调 SiHa 细胞的 cyclin B 和 Cdk-2 表达,可以调节细胞周期停滞。</p>
体内研究	<p>PP2 每天按 5 mg/kg 剂量处理脾脏接种 HT29 细胞的 SCID 小鼠,与对照组相比,降低原代肿瘤的生长率。PP2 每天按 5 mg/kg 剂量处理脾脏接种 HT29 细胞的 SCID 小鼠,与对照组相比,显著降低了相对肝重和肝转移量。PP2 按 1.5 mg/kg 剂量腹腔注射处理局灶性脑缺血损伤的大鼠,降低约 50%梗死面积。PP2 按 1.5 mg/kg 剂量腹腔处理局灶性脑缺血损伤的大鼠,与对照组相比,具有更好的神经功能评分。</p>

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)

MB3961	PP1
--------	-----

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。PP2 是 Src 家族激酶抑制剂,有效抑制 Lck/Fyn,本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.3138 mL	16.5689 mL	33.1378 mL
5 mM	0.6628 mL	3.3138 mL	6.6276 mL
10 mM	0.3314 mL	1.6569 mL	3.3138 mL

50 mM	0.0663 mL	0.3314 mL	0.6628 mL
-------	-----------	-----------	-----------

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>体外激酶实验: 使用适当的质粒瞬时转染亚融合的 HEK293 细胞, 然后溶解在裂解液中。使用所需的抗体进行蛋白免疫沉淀, 使用蛋白 A 琼脂糖珠回收免疫复合物, 使用激酶缓冲液洗涤 5 次, 在有 PP2 或空白对照存在时, 在含 200 μM 聚 (L-谷氨酸-L-酪氨酸) (聚-GT), 2.5 μCi$[\gamma$-32P]ATP 和未标记的 ATP (终浓度为 20 μM) 的激酶缓冲液中室温下温育 20 分钟。样品点样在 Whatman 3MM 纸上, 使用 1% 正磷酸洗涤五次。使用 β-闪烁计数器测量 32P 摄入量。使用谷胱甘肽琼脂糖凝胶纯化来自 HEK293 细胞裂解液中的谷胱甘肽-S-转移酶 (GST) -RET/酪氨酸激酶 (TK)。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: HT29, SW480, PMCO1, PLC/PRF/5, KYN-2, Li7, HepG2, MCF-7, MDA-MB-468 和 BT-474 细胞系 Concentrations: ~100 μM Incubation Time: 2 天 Method: 使用体外毒理学检测试剂盒测定细胞活力。在实验第 0 天, 细胞接种在 96 孔板中。实验第 1 天, 使用浓度不断增加的 PP2 (1 μM, 10 μM, 和 100 μM) 处理细胞 2 天。末期时, 通过比色法, 根据 MTT 裂解, 通过活细胞中线粒体脱氢酶, 形成甲臜, 测评细胞增殖。使用 10 种实验浓度, 重复进行此实验三次。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 脾脏接种 HT29 细胞的 SCID 小鼠 Formulation: 1% DMSO Dosages: 5 mg/kg/day Administration: 腹腔注射</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。