

PAC-1

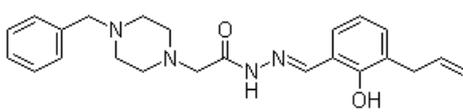
产品编号: MB4074

质量标准: >98%, procaspase-3 激活剂

包装规格: 10MG;50MG;250MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C23H28N4O2	结构式	
分子量	392.49		
CAS No.	315183-21-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 78 mg/mL (198.73 mM) Water: Insoluble Ethanol: 16 mg/mL (40.76 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: PAC-1 是一种 procaspase-3 激活剂, 诱导癌细胞凋亡。

别名: 半胱天冬酶原活化物 1; Procaspase activating compound 1; 1-Piperazineacetic acid, 4-(phenylmethyl)-, 2-[[2-hydroxy-3-(2-propen-1-yl)phenyl]methylene]hydrazide

物理性状及指标:

外观:白色或类白色固体

溶解性:DMSO: 78 mg/mL (198.73 mM); Water: Insoluble; Ethanol: 16 mg/mL (40.76 mM)

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	PAC-1 是有效的 procaspase-3 激活剂, EC50 为 0.22 μM, 是第一个已知的直接激活 procaspase-3 为 caspase-3 的小分子。
靶点	Procaspase-3
IC50	0.22 μM
体外研究	PAC-1 激活 procaspase-3, 产生 caspase-3, EC50 为 0.22 μM, 且激活 procaspase-7, EC50 为 4.5 μM。癌细胞系中增高的 caspase 3 水平使 PAC-1 选择性诱导凋亡, 按与

	procaspase-3 浓度成比例的方式, IC50 为作用于 NCI-H226 细胞的 0.35 μM 到作用于 UACC-62 细胞的~3.5 μM 。PAC-1 作用于原发性癌细胞, 诱导凋亡, IC50 为 3 nM 到 1.41 μM , 更有效作用于邻近的非癌细胞, IC50 为 5.02 μM 到 9.98 μM , 与不同的 procaspase-3 浓度直接相关。PAC-1 通过整合锌离子而激活 procaspase-3, 因此缓解锌-介导的抑制, 且使 procaspase-3 激活自身变为 caspase-3。PAC-1 作用于 Bax/Bak 双基因敲除细胞和, 及 Bcl-2 和 Bcl-xL-过表达细胞, 诱导细胞死亡。PAC-1 按 caspase-3 非依赖性方式诱导细胞色素 c 释放, 随后触发下游 caspase-3 激活和细胞死亡。PAC-1 作用于 Apaf-1 基因敲除细胞, 不会诱导细胞凋亡和 caspase-3 激活, 说明通过 PAC-1 介导的细胞死亡形成凋亡体, 对激活 caspase-3 是必不可少的。
体内研究	PAC-1 按 5 mg 的稳定释放低剂量处理小鼠, 显著抑制 ACHN 肾移植瘤生长。PAC-1 按 50 或 100 mg/kg 剂量口服处理, 显著阻碍 NCI-H226 肺癌移植瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 且显著阻止癌细胞浸润肺组织。PAC-1 体内抗肿瘤效果归因于激活 procaspase-3 和随后诱导凋亡, 与体外活性一致。
特征	PAC-1 是第一个使 procaspase-3 直接激活为 caspase-3 的小分子试剂。

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)

MB3318	Ac-DEVD-CHO(Caspase 3 抑制剂)
MB4575	Q-VD-Oph
MB4124	凋亡激活剂 2

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。PAC-1 是一种 procaspase-3 激活剂, 诱导癌细胞凋亡。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5478 mL	12.7392 mL	25.4784 mL
5 mM	0.5096 mL	2.5478 mL	5.0957 mL
10 mM	0.2548 mL	1.2739 mL	2.5478 mL
50 mM	0.0510 mL	0.2548 mL	0.5096 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>体外 procaspase-3 激活实验:</p> <p>表达 Procaspase-3, 然后在大肠杆菌中纯化。不同浓度 PAC-1 加到 96 孔板中, 孔中为含 90 μL 50 ng/mL procaspase-3 的 caspase 实验 buffer, 实验板在 37°C 下温育 12 小时。Caspase 实验 buffer 中的 10 μL 2 mM caspase-3 肽底物乙酰 Asp-Glu-Val-Asp-p-nitroanilide (Ac-DEVD-pNa) 溶液加到每孔中。实验板在 Spectra Max Plus 384 孔酶标仪上 405 nm 处每两分钟读数一次, 持续 2 小时。测定每孔的直线部分斜率, 且计算对照组激活的相对增高量。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: U-937, HL-60, CRL-1872, ACHN, NCI-H226, Hs888Lu, Hs578Bst, MCF-10A, SK-MEL-5, BT-20, MDA-MB-231, UACC-62, SK-N-SH, B16-F10, Hs 578t, 和 PC-12</p> <p>Concentrations: 溶于 DMSO, 终浓度为~100 μM</p>

	Incubation Time: 72 小时 Method: 使用不同浓度 PAC-1 处理细胞 72 小时。加入 MTS/PMS CellTiter 96 细胞增殖检测试剂定量测定细胞死亡。实验板在 37°C 下温育约 1 小时(直到形成有色产物), 在 490 nm 处测定吸光值。
动物实验	Animal Models: 皮下注射 ACHN 细胞的卵巢切除的雌性无胸腺 BALB/c(nu/nu)裸鼠, 皮下注射 NCI-H226 细胞的胸腺无胸腺 BALB/c 裸鼠, 静脉注射 NCI-H226 细胞的雄性无胸腺 BALB/c ^{-/-} 小鼠。 Formulation: 与胆固醇混合, 制成 3mm 直径 20mg(全部重量) 的颗粒, 或者溶于 24:1 植物油/DMSO 的混合物。 Dosages: ~100 mg/kg Administration: 颗粒皮下移植或口服处理

【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, 否则会严重影响化合物活性, 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。