

PF8380 ; PF-8380

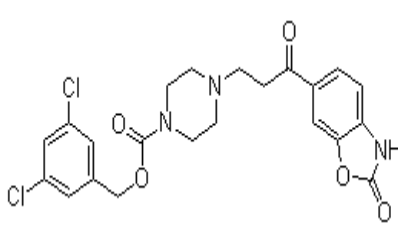
产品编号 : MB4322

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H21Cl2N3O5	结 构 式	
分子量	478.33		
CAS No.	1144035-53-9		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 95 mg/mL (198.6 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 : PF-8380 是一种有效的 autotaxin 抑制剂。

别名 : 1-Piperazinecarboxylic acid, 4-[3-(2,3-dihydro-2-oxo-6-benzoxazolyl)-3-oxopropyl]-, (3,5-dichlorophenyl)methyl ester

物理性状及指标 :

外观 :类白色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 95 mg/mL (198.6 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

产品描述	PF-8380 是一种有效的自毒素抑制剂, 在体外酶活性实验中测得 IC50 为 2.8 nM。
靶点	Autotaxin(Cell-free assay) 2.8 nM
体外研究	PF-8380 与 FS-3D 底物抑制大鼠自毒素, 其 IC50 为 1.16 nM。人体全血处理以该化合物 2 小时, 自毒素被抑制, IC50 为 101 nM。PF-8380 在 GBM 细胞中抑制自毒素后导致其减少入侵、迁移以及增强辐射敏化。辐射所诱导的 AKT 激活可被 ATX (autotaxin) 的抑制所阻

	止。ATX 的抑制导致肿瘤血管的减少、肿瘤生长阻滞、延迟。
体内研究	在放射辐射前进行 PF-8380 的预处理可抑制辐射诱导的肿瘤血管内皮细胞的血管生成、在体内延迟神经胶质瘤肿瘤生长与发展。在大鼠气囊炎模型中，口服 30 mg/kg 的 PF8380 可减少炎性痛觉过敏，3 小时内，在血浆和炎症组织位置造成大于 95% 的 LPA 水平降低。

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。PF-8380 是一种有效的 autotaxin 抑制剂。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	2.0906 mL	10.4530 mL	20.9061 mL
5 mM	0.4181 mL	2.0906 mL	4.1812 mL
10 mM	0.2091 mL	1.0453 mL	2.0906 mL
50 mM	0.0418 mL	0.2091 mL	0.4181 mL

经典实验操作（仅供参考）

细胞实验	<p>Cell lines: 小鼠 GL261 和人 U87-MG 细胞</p> <p>Concentrations: 1 μM</p> <p>Incubation Time: 45 min</p> <p>Method: 在细胞培养板中培养 GL261 或 U87-MG 细胞，使其达到 70% 融合率。用无菌的 200 μL 枪头将半融合细胞层 (semi-confluent cell layer) 轻轻刮下，以形成一层无细胞层。用 PBS 清洗一遍平板，以移除非黏连细胞和细胞碎片。对于放射线增减药物研究，细胞在辐射实验前用 1 μM PF-8380 或 DMSO 处理 45 分钟，然后置于 37$^{\circ}$C，5% CO₂ 中培养。对照板用于观测其细胞迁移 (20-24h)。细胞用 70% 乙醇固定，用 1% 亚甲蓝染色。为了计算其迁移，在刮层区域选择任意三个 HPFs 进行统计。</p>
动物实验	<p>Animal Models: Male Lewis rats</p> <p>Formulation: 溶解于 dioxane (50 ml) 和水 (50 ml) 中，加入碳酸氢钠(16.1 g, 152 ml)。</p> <p>Dosages: 1, 3, 10, 30, and 100 mg/kg</p> <p>Administration: 口服</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。