

Panobinostat (LBH589, NVP-LBH589); 帕比司他

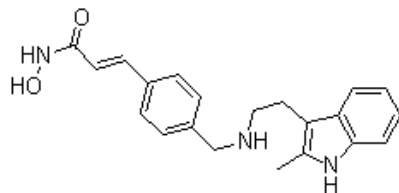
产品编号: MB5709

质量标准: >98%, 广谱 HDAC 抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C21H23N3O2	结 构 式	
分子量	349.43		
CAS No.	404950-80-7		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25° C)	DMSO: 69 mg/mL (197.46 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: 帕比司他 Panobinostat 是一种非选择性组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂。

别名: LBH589; NVP-LBH589; 2-Propenamide,

N-hydroxy-3-[4-[[[2-(2-methyl-1H-indol-3-yl)ethyl]amino]methyl]phenyl]-, (2E)-

物理性状及指标:

外观:白色至卡其色固体

溶解性:DMSO: 69 mg/mL (197.46 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	LBH589 (Panobinostat)是新型的, 广谱 HDAC 抑制剂, IC50 为 5 nM。	
靶点	MOLT-4 细胞	Reh 细胞
IC50	5 nM	20 nM
体外研究	LBH589 诱导 MOLT-4 和 Reh 细胞凋亡, 这种作用具有时间和剂量依赖性。而且, LBH589 作用于 MOLT-4 细胞比作用于 Reh 细胞更有效。LBH589 明显阻止 MOLT-4 和 Reh 细胞的生长, 处理 48 小时, 具有剂量依赖性。与对照组细胞相比, 用 LBH589 处理的细胞, 在细胞周期的 G2/M 期的细胞数量增多 2 到 3 倍。LBH589 与组蛋白 H3K9 和 H4K8 的乙酰化作用相关, LBH589 也降低 c-Myc 的表达水平, 具有剂量依赖性。LBH589 也增强 p21 的表达水平。最低剂量的 LBH589 (10 nM) 处理 Reh 细胞, 最初增强 c-Myc 的表达水平, 之后一直降低 c-Myc 的表达水平。此外, LBH589 促进 mRNA 水平的促凋亡和 DNA 修复基因的大量增多。在 GADD45G 启动子作用下, LBH589 诱导乙酰化的组蛋白 H3 和 H4 水平的增多。此外, LBH589 抑制非小细胞肺癌细胞系生长, 如人类 H1299, L55 和 A549, IC50 分别为 5, 11 和 30 nM; 间皮瘤细胞生长, 如人类 OK-6 和 OK-5, IC50	

	分别为 5 和 7 nM; 及小细胞肺癌细胞系生长, 如人类 RG-1 和 LD-T, IC50 分别为 4 和 5 nM。
体内研究	LBH589 作用于患肺癌和间皮瘤动物模型, 明显降低肿瘤生长, 与对照组相比平均降低 62%。 LBH589 作用于免疫活性鼠和严重联合免疫缺陷鼠效果差不多, 说明 LBH589 抑制肿瘤生长与免疫学无关。LBH589 按 20 mg/kg 剂量腹腔注射, 每周持续 5 天, 导致在实验最后肿瘤生长平均下降 70%。与相应的对照组肿瘤相比, LBH589 作用于 H526 衍生的肿瘤下降 53%, 作用于 BK-T 衍生的肿瘤下降 81%, 作用于 RG-1 衍生的肿瘤下降 76%, 作用于 H69 衍生的肿瘤下降 70%。在相同条件和剂量的情况下, LBH589 作用于 NSCLC 和 Meso 衍生的移植瘤, 导致 SCLC 衍生的肿瘤中有两种衰退, 伴随着 BK-T 衍生的平均肿瘤尺寸从实验开始时的 296 mm ³ 降低到实验结束时的 116 mm ³ , RG-1 衍生的平均肿瘤尺寸从实验开始时的 185mm ³ 降低到实验结束时的 86 mm ³ 。

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)

MB3550	LMK235
MB3741	MC1568
MB3742	PCI-24781 (Abexinostat)

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。帕比司他 Panobinostat 是一种非选择性组蛋白去乙酰化酶 (HDAC) 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.8618 mL	14.3090 mL	28.6180 mL
5 mM	0.5724 mL	2.8618 mL	5.7236 mL
10 mM	0.2862 mL	1.4309 mL	2.8618 mL
50 mM	0.0572 mL	0.2862 mL	0.5724 mL

经典实验操作 (仅供参考)

细胞实验:	Cell lines: MOLT-4 细胞和 Reh (前体 B 细胞) Concentrations: 50 nM Incubation Time: 48 小时 Method: 没有处理的细胞和 LBH589 处理的细胞 [人类急性成淋巴细胞性白血病 MOLT-4 (T 细胞) 和 Reh (前体-B 细胞)] 用膜联蛋白 V 和碘化丙啶染色, 然后加入膜联蛋白 V-FITC 细胞凋亡检测试剂盒 I。通过流式细胞仪测定细胞凋亡和不能存活细胞的百分比。用 CyAn ADP Violet 细胞计数器收集至少 5×10^4 个细胞。根据所有的膜联蛋白 V-阳性和膜联蛋白 V/PI-阳性细胞计算凋亡百分比, 根据所有的膜联蛋白 V-阳性和 PI-阳性及膜联蛋白 V/PI-阳性细胞计算细胞活力丢失百分比。
动物实验:	Animal Models: 携带 10×10^6 个 M30 细胞或 5×10^6 个 A549 细胞的 SCID 鼠 Formulation: 溶于水的 5% 葡萄糖 Dosages: 10 mg/kg, 20 mg/kg Administration: 腹腔注射

【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) × 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。