

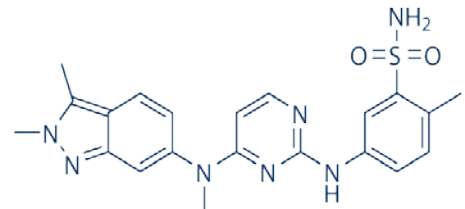
Pazopanib (VEGFR抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0218-10mM	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0218-5mg	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SC0218-25mg	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	5-[[4-[(2,3-dimethylindazol-6-yl)-methylamino]pyrimidin-2-yl]amino]-2-methylbenzenesulfonamide
简称	Pazopanib
别名	GW780604, GW 780604, GW-780604, GW786034B, GW 786034B, GW-786034B, Votrient
中文名	帕唑帕尼
化学式	C ₂₁ H ₂₃ N ₇ O ₂ S
分子量	437.52
CAS号	444731-52-6
纯度	99.4%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 87mg/ml warmed; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.14ml DMSO, 或每4.38mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0218-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Pazopanib是一种新型多靶点的VEGFR1、VEGFR2、VEGFR3、PDGFR、FGFR、c-Kit和c-Fms抑制剂, 无细胞试验中IC50分别为10nM、30nM、47nM、84nM、74nM、140nM和146nM。				
信号通路	Protein Tyrosine Kinase; Angiogenesis				
靶点	VEGFR1	VEGFR2	VEGFR3	FGFR	PDGFR
IC50	10nM	30nM	47nM	74nM	84nM
体外研究	Pazopanib有效抑制VEGF诱导的HUVEC细胞中VEGFR2磷酸化作用, IC50为8nM。在所有滑膜肉瘤细胞系, 包括SYO-1和HS-SY-II细胞中, Pazopanib表现出剂量依赖性生长抑制作用。SYO-1和HS-SY-II细胞的增殖在1μg/ml的Pazopanib下被抑制, 在5μg/ml的Pazopanib下被完全废止。Pazopanib引起G1期阻滞, 并且因此抑制滑膜肉瘤细胞的生长。与载体处理的细胞相比, Akts、GSK-3β、JNKs、p70 S6激酶和mTOR的磷酸化作用在Pazopanib处理的SYO-1细胞中被抑制。Pazopanib在20mg/ml和22.5mg/ml之间表现出逐渐增加的RPE细胞活性降低。				
体内研究	与用载体或10mg/kg Pazopanib处理的小鼠相比, 用30mg/kg或100mg/kg Pazopanib处理的小鼠, 肿瘤负荷显著降低。Pazopanib治疗具有良好的耐受性, 并且每组小鼠的体重差异没有明显不同。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	对VEGFR1、VEGFR2和VEGFR3的VEGFR酶试验, 在均相时间分辨荧光(HTRF)格式下进行, 在384孔微量滴定板, 使用纯化的杆状病毒表达的谷胱甘肽-S-转移酶(GST)融合蛋白, 编码催化的人VEGFR受体激酶1、2或3的C端。将10μl激活的VEGFR2激酶溶液[终浓度0.1M HEPES含1nM酶(pH7.5)、含有0.1mg/ml牛血清白蛋白(BSA)、300μM二硫苏糖醇(DTT)]加入到10μl底物溶液[终浓度360nM多肽、(生物素-氨基己基-EEEEYFELVAKKKK-NH ₂)、75μM ATP、10μM MgCl ₂]和1μl滴定的Pazopanib的DMSO溶液启动反应。平板在室温下培育60分钟, 随后加入20μl 100mM乙二胺四乙酸(EDTA)淬灭反应。终止反应后, 加入20μl

	HTRF试剂(终浓度15nM链霉亲和素联别藻蓝蛋白、在0.1mg/ml BSA中稀释的1nM Europium标记的抗磷酸酪氨酸抗体、0.1M HEPES(pH7.5)), 将平板再至少培育10分钟。在665nm下的荧光通过Wallac Victor平板阅读器使用50μs的时间延迟进行测定。
--	--

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	含有SYO-1细胞的免疫缺陷小鼠
配制	N/A
剂量	0mg/kg、10mg/kg、30mg/kg或100mg/kg
给药方式	口服给药

参考文献:

1. Harris PA, et al. J Med Chem. 2008; 51(15):4632-4640.
2. Hosaka S, et al. J Orthop Res. 2012 Sep; 30(9):1493-8.
3. Kernt M, et al. Retina. 2012 Sep; 32(8):1652-63.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0218-10mM	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0218-5mg	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	5mg
SC0218-25mg	Pazopanib (VEGFR抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20°C保存, 至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存, 至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂, 建议分装后-80°C保存, 预计6个月有效。

注意事项:

- 本产品仅限于专业人员的科学研究用, 不得用于临床诊断或治疗, 不得用于食品或药品, 不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。

使用说明:

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒, 以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液, 可直接稀释使用。对于固体, 请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献, 或者根据实验目的, 以及所培养的特定细胞和组织, 通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页:
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.02.09