

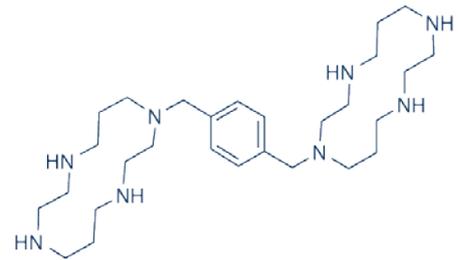
## Plerixafor (CXCR拮抗剂)

产品编号	产品名称	包装
SD2380-1mM	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	1mM×2ml
SD2380-5mg	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	5mg
SD2380-25mg	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	1-[[4-(1,4,8,11-tetrazacyclotetradec-1-ylmethyl)phenyl]methyl]-1,4,8,11-tetrazacyclotetradecane
简称	Plerixafor
别名	AMD3100, AMD 3100, AMD 3329, AMD-3100, AMD-3329, Bicyclam, JM 3100, JM-3100, JM3100, Mezobil, Mozobil, Plerixafor hydrochloride, RPA bicyclam
中文名	普乐沙福
化学式	C <sub>28</sub> H <sub>54</sub> N <sub>8</sub>
分子量	502.78
CAS号	110078-46-1
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water 3mg/ml warming; DMSO <1mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入9.9ml DMSO, 或每0.503mg加入1ml DMSO, 配制成1mM溶液。SD2380-1mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Plerixafor (AMD3100)是一种趋化因子受体拮抗剂, 作用于CXCR4和CXCL12介导的趋化性, 无细胞试验中IC50分别为44nM和5.7nM。				
信号通路	GPCR & G Protein				
靶点	CXCL12-mediated chemotaxis	CXCR4	—	—	—
IC50	5.7nM	44nM	—	—	—
体外研究	Plerixafor抑制CXCL12介导的趋药性, 效能稍微高于其对CXCR4的亲合力。Plerixafor也会拮抗SDF-1/CXCL12配体结合, IC50为651nM。Plerixafor抑制SDF-1介导的GTP-结合, SDF-1介导的钙离子流和SDF-1刺激的趋药性, IC50分别为27nM、572nM和51nM。用它们的同源配体刺激时, Plerixafor不抑制表达CXCR3、CCR1、CCR2b、CCR4、CCR5或者CCR7的细胞中钙离子流, Plerixafor也不会抑制LTB4的受体结合。Plerixafor自身不会在表达多重GPCRs, 包括CXCR4、CCR4和CCR7的CCRF-CEM细胞中诱导钙离子流。				
体内研究	在糖尿病小鼠体内, Plerixafor单剂量局部给药促进伤口愈合, 通过增加细胞因子产生, 动员骨髓EPCs, 并增强成纤维细胞和单核细胞/巨噬细胞, 从而增加血管新生和血管生成发挥作用。同类小鼠以PBS、IGF1、PDGF、SCF或VEGF连续给药5天, 在第5天给药Plerixafor。与PDGF、SCF和VEGF结合Plerixafor的试验组相比, IGF1加Plerixafor的注射小鼠中, 菌落的数量和大小最高。				
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	对于CXCR4的竞争性结合研究, 不同浓度的Plerixafor于4°C, 在结合缓冲液(PBS包含5mM MgCl <sub>2</sub> , 1mM

	CaCl <sub>2</sub> , 0.25% BSA, pH 7.4)中与5×10 <sup>5</sup> CCRF-CEM细胞和100 pM 125I-SDF-1α(2200Ci/mmol)在Milipore Durapore™滤板上培育3小时。未结合125I-SDF-1α通过冷的50mM HEPES, 0.5 M NaCl pH 7.4洗涤移除。对BLT1的竞争性结合试验在来自表达重组BLT1的CHO-S细胞的细胞膜上进行。细胞膜通过机械性细胞裂解制备, 随后高速离心分离, 重悬浮在50mM HEPES, 5mM MgCl <sub>2</sub> 缓冲液中, 并急速冷冻。细胞膜制剂与Plerixafor在室温下, 在包含50mM Tris, pH 7.4, 10mM MgCl <sub>2</sub> , 10mM CaCl <sub>2</sub> , 4nM LTB4混合1nM 3H-LTB4(195.0Ci/mmol) 以及8μg细胞膜的试验混合物中培育。未结合3H-LTB4通过在Millipore型GF-C过滤板上过滤分离。
--	--

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	节段性骨缺损的12周大C57BL/6小鼠
配制	PBS
剂量	5mg/kg
给药方式	i.p.

### 参考文献:

1. Zabel BA, et al. J Immunol. 2009, 183(5), 3204-3211.
2. Fricker SP, et al. Biochem Pharmacol. 2006, 72(5), 588-596.
3. Nishimura Y, et al. J Invest Dermatol. 2012, 132(3 Pt 1), 711-720.
4. Kumar S, et al. Bone. 2012, 50(4), 1012-1018.

### 包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SD2380-1mM	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	1mM×2ml
SD2380-5mg	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	5mg
SD2380-25mg	Plerixafor (CXCR拮抗剂)	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:

- 本产品对人体有害, 操作时请小心, 并注意有效防护以避免直接接触人体或吸入体内。
- 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淀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成高浓度的储备液(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、体内研究结果或其他相关文献, 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的等效剂量转换表请参考如下网页:  
<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2023.11.01