

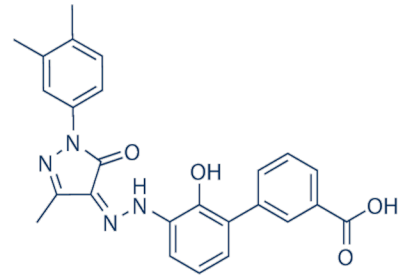
Eltrombopag (TpoR激动剂)

产品编号	产品名称	包装
SF1127-10mM	Eltrombopag (TpoR激动剂)	10mM×0.2ml
SF1127-5mg	Eltrombopag (TpoR激动剂)	5mg
SF1127-25mg	Eltrombopag (TpoR激动剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	3-[(5E)-5-[[2-(3,4-dimethylphenyl)-5-methyl-3-oxo-1H-pyrazol-4-yl]hydrazinylidene]-6-oxocyclohexa-1,3-dien-1-yl]benzoic acid
简称	Eltrombopag
别名	Promacta, Revolade, SB-497115, SB 497115, SB497115
中文名	伊屈泼帕
化学式	C ₂₅ H ₂₂ N ₄ O ₄
分子量	442.47
CAS号	496775-61-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 26mg/ml warming; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.13ml DMSO, 或每4.42mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF1127-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Eltrombopag, 属于biarylhydrazone小分子, 是一种thrombopoietin receptor (TpoR)的非肽类激动剂, 用于治疗慢性丙型肝炎相关的血小板减少和慢性免疫性(自发的)血小板减少(ITP)。				
信号通路	Others				
靶点	thrombopoietin receptor (TpoR)	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	含有STAT激活的IRF-1启动子和人TpoR (BAF3/IRF-1/hTpoR)调控的转染荧光素酶报告基因的小鼠BAF3细胞中, Eltrombopag表现出的半数最大有效浓度(EC50)为0.27μM。Eltrombopag通过结合金属铁(i.e., Zn ²⁺)和TpoR的跨膜与近膜结构域内特异性氨基酸, 从而激活受体。抗磷酸-STAT5抗体免疫印迹检测表明, Eltrombopag(30μM)激活N2C-Tpo细胞中STAT5。培育2天后, Eltrombopag刺激增殖, 对BAF3/hTpoR细胞进行BrdU测定, EC50为0.03μM。Eltrombopag也会诱导造血干细胞分化为巨核祖细胞。Eltrombopag剂量依赖性增加骨髓CD34 ⁺ 细胞分化为CD41 ⁺ 巨核细胞, EC50为0.1μM。Eltrombopag抑制N2C-Tpo细胞和HEL92.1.7细胞增殖, IC50分别为20.7μg/ml和2.3μg/ml。在人和小鼠白血病细胞中, Eltrombopag(20μg/ml)导致细胞分裂率减少, 细胞周期G(1)期阻滞, 以及细胞分化增加。HL60细胞中, Eltrombopag(5μg/ml)表现出明显的分化信号, 显著改变细胞核内容物的结构, 并增加细胞质/细胞核比率。Eltrombopag(5μg/ml)增加CD11b, 这与U937细胞中前巨噬细胞状态一致, 并引起URE细胞中CD11b的增加。白血病HL60细胞中, Eltrombopag导致细胞内游离铁离子剂量依赖性减少。				
体内研究	Eltrombopag(10mg/kg每天)最后一次给药1周后, 使一只黑猩猩体内的血细胞数量大约增加超过2倍, 另外两只黑猩猩体内大约增加1.5倍。Eltrombopag(1mg/ml)延长白血病小鼠模型的存活时间。				
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	N/A

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	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

- 1.Erickson-Miller CL, et al. Stem Cells, 2009, 27(2), 424-430.
- 2.Erickson-Miller CL, et al. Leuk Res, 2010, 34(9), 1224-1231.
- 3.Roth M, et al. Blood, 2012, 120(2), 386-394.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF1127-10mM	Eltrombopag (TpoR激动剂)	10mM×0.2ml
SF1127-5mg	Eltrombopag (TpoR激动剂)	5mg
SF1127-25mg	Eltrombopag (TpoR激动剂)	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:

- 本产品对人体有毒，操作时请特别小心，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等效剂量转换表请参考如下网页：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01