

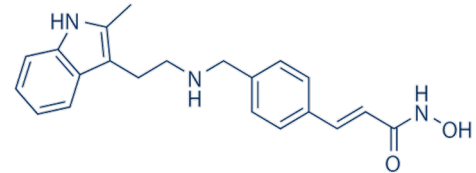
Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0294-10mM	Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0294-5mg	Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)	5mg
SC0294-25mg	Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(E)-N-hydroxy-3-[4-[[2-(2-methyl-1H-indol-3-yl)ethylamino]methyl]phenyl]prop-2-enamide
简称	Panobinostat
别名	Farydak; LBH-589; LBH 589; LBH589; NVP-LBH589; panobinostat; Faridak; LBH-589B; HY-10224
中文名	帕比司他
化学式	C ₂₁ H ₂₃ N ₃ O ₂
分子量	349.43
CAS号	404950-80-7
纯度	100.0%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 69mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.43ml DMSO, 或每3.49mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0294-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Panobinostat (LBH589)是一种新型的, 广谱HDAC抑制剂, 无细胞试验中IC50为5nM。Phase 3。			
信号通路	Epigenetics; DNA Damage; NF-κB			
靶点	HDAC (MOLT-4 cells)	HDAC (Reh cells)	—	—
IC50	5nM	20nM	—	—
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(10nM)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30nM; 间皮瘤细胞生长, 如人类OK-6和OK-5, IC50分别为5和7nM; 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5nM。			
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20mg/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296mm ³ 降低到实验结束时的116mm 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86mm ³ 。			
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	MOLT-4细胞和Reh(前体B细胞)
浓度	50nM
处理时间	48h
方法	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	
动物模型	携带 10×10^6 个M30细胞或 5×10^6 个A549细胞的SCID鼠
配制	溶于水的5%葡萄糖
剂量	10mg/kg, 20mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ 参考文献:

1. Maiso P, et al. Cancer Res. 2006; 66(11):5781-5789.
2. Scuto A, et al. Blood. 2008; 111(10):5093-5100.
3. Crisanti MC, et al. Mol Cancer Ther. 2009; 8(8):2221-2231.
4. Atadja P, Cancer Lett. 2009; 280(2):233-241.
5. Ocio EM, et al. Haematologica. 2010; 95(5):794-803.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0294-10mM	Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0294-5mg	Panobinostat (LBH589) (HDAC抑制剂)	5mg
SC0294-25mg	Panobinostat (LBH589) (HDAC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