

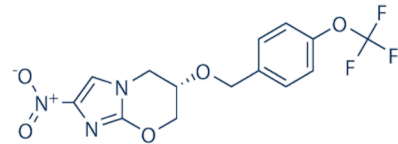
PA-824 (抗肺结核药)

产品编号	产品名称	包装
SF1145-10mM	PA-824 (抗肺结核药)	10mM×0.2ml
SF1145-5mg	PA-824 (抗肺结核药)	5mg
SF1145-25mg	PA-824 (抗肺结核药)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	(6S)-2-nitro-6-[[4-(trifluoromethoxy)phenyl]methoxy]-6,7-dihydro-5H-imidazo[2,1-b][1,3]oxazine
简称	PA-824
别名	PA 824, PA824, PA824 cpd
中文名	N/A
化学式	C ₁₄ H ₁₂ F ₃ N ₃ O ₅
分子量	359.26
CAS号	187235-37-6
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 72mg/ml; Ethanol 16mg/ml
溶液配制	5mg加入1.39ml DMSO, 或每3.59mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SF1145-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	PA-824是一种抗肺结核药, 作用于tuberculosis, MIC为<1μg/ml。Phase 2。				
信号通路	Others				
靶点	tuberculosis	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	在体外, PA-824对来自亚洲(印度和韩国)和全美国(MIC<1μg/ml)的多药耐药临床菌株表现出高活性, 并且对药物敏感性和多药耐药性结核杆菌菌株同样有效(MICs范围, 0.039到0.531μg/ml)。一项最近的研究表明PA-824耐药基因(fgd1 [Rv0407]和ddn [Rv3547])的单核苷酸多态性对PA-824 MICs(≤0.25μg/ml)无显著影响。				
体内研究	在急性肺结核小鼠模型中, PA-824表现出显著的剂量依赖性抗肿瘤活性: 溶于MC的PA-824, 50mg/kg, 使肺中CFU产生超过1-log的减少; 100mg/kg, 产生2-log的减少; 300mg/kg, 产生3-log的减少。此外, PA-824(100mg/kg)在环糊精/卵磷脂中长期治疗导致细菌负荷量减少, 在肺和脾中低于500CFU。在肺结核小鼠模型中, PA-824表现出时间依赖性抗菌活性, 24天中观察到的最大杀菌作用为0.1 log CFU/天。				
临床实验	N/A				
特征	实验性抗结核药。				

➤ 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	结核分枝杆菌H37Rv
浓度	2.0μg/ml-8.0pg/ml
处理时间	21天
方法	一种用于测定MICs的方法通过微量稀释平板法使用结核分枝杆菌H37Rv进行。INH以500μg/ml的原浓度溶解于无菌的双蒸馏水中。PA-824溶解于100%二甲基亚砜(DMSO), 原浓度为100μg/ml。两种化合物的一系列1: 2稀释物在单独的96微孔板中使用相同稀释剂制备。96孔圆底微量滴定测定板内部的60孔接种98μl细菌悬浮液。将2μl每种药物转移到包含细菌的测试板。INH在孔中的终浓度范围为10.0到

	0.039µg/ml; PA-824的终浓度范围为2.0µg/ml到8.0pg/ml。测试板在37°C下至少培养21天，然后观察3到4天以评估生长的改变。生长的抑制通过肉眼检查和分光光度计在OD600下测定。
--	----------------------------------------------------------------------------------------------------------

动物实验	
动物模型	γ干扰素基因被破坏的(GKO)小鼠，通过小剂量气雾剂暴露于结核分枝杆菌Erdman被感染。
配制	PA-824溶于0.5%甲基纤维素(MC)或环糊精/卵磷脂(CM2)中
剂量	≤300mg/kg
给药方式	口服给药

➤ **参考文献:**

- 1.Lenaerts AJ, et al. Antimicrob Agents Chemother. 2005, 49(6), 2294-2301.
- 2.Feuerriegel S, et al. Antimicrob Agents Chemother. 2011, 55(12), 5718-5722.
- 3.Ahmad Z, et al. Antimicrob Agents Chemother. 2011, 55(1), 239-245.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SF1145-10mM	PA-824 (抗肺结核药)	10mM×0.2ml
SF1145-5mg	PA-824 (抗肺结核药)	5mg
SF1145-25mg	PA-824 (抗肺结核药)	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:

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并注意适当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 2017.11.01