

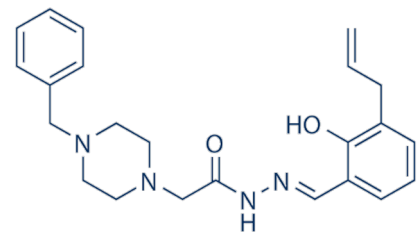
## PAC-1 (Caspase激活剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4336-10mM	PAC-1 (Caspase激活剂)	10mM×0.2ml
SC4336-5mg	PAC-1 (Caspase激活剂)	5mg
SC4336-25mg	PAC-1 (Caspase激活剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	2-(4-benzylpiperazin-1-yl)-N'-[(Z)-(6-oxo-5-prop-2-enylcyclohexa-2,4-dien-1-ylidene)methyl]acetohydrazide
简称	PAC-1
别名	PAC1, PAC 1, Procaspase-3 Activator
中文名	N/A
化学式	C <sub>23</sub> H <sub>28</sub> N <sub>4</sub> O <sub>2</sub>
分子量	392.49
CAS号	315183-21-2
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 78mg/ml; Ethanol 16mg/ml
溶液配制	5mg加入1.27ml DMSO, 或每3.92mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4336-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PAC-1是一种有效的procaspase-3(酶原-3)激活剂, EC <sub>50</sub> 为0.22μM, 是第一个已知的直接激活酶原e-3为caspase-3的小分子。				
信号通路	Apoptosis; Proteases				
靶点	Procaspase-3	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	0.22μM(EC <sub>50</sub> )	—	—	—	—
体外研究	PAC-1激活procaspase-3, 产生caspase-3, EC <sub>50</sub> 为0.22μM, 且激活procaspase-7, EC <sub>50</sub> 为4.5μM。癌细胞系中增高的caspase 3水平使PAC-1选择性诱导凋亡, 按与procaspase-3浓度成比例的方式, IC <sub>50</sub> 为作用于NCI-H226细胞的0.35μM到作用于UACC-62细胞的~3.5μM。PAC-1作用于原发性癌细胞, 诱导凋亡, IC <sub>50</sub> 为3nM到1.41μM, 更有效作用于邻近的非癌细胞, IC <sub>50</sub> 为5.02μM到9.98μM, 与不同的procaspase-3浓度直接相关。PAC-1通过螯合锌离子而激活procaspase-3, 因此缓解锌-介导的抑制, 且使procaspase-3激活自身变为caspase-3。PAC-1作用于Bax/Bak双基因敲除细胞及Bcl-2和Bcl-xL-过表达细胞, 诱导细胞死亡。PAC-1按caspase-3非依赖性方式诱导细胞色素c释放, 随后触发下游caspase-3激活和细胞死亡。PAC-1作用于Apaf-1基因敲除细胞, 不会诱导细胞凋亡和caspase-3激活, 说明通过PAC-1介导的细胞死亡形成凋亡体, 对激活caspase-3是必不可少的。				
体内研究	PAC-1按5mg的稳定释放低剂量处理小鼠, 显著抑制ACHN肾移植瘤生长。PAC-1按50或100mg/kg剂量口服处理, 显著阻碍NCI-H226肺癌移植瘤生长, 这种作用存在剂量依赖性, 且显著阻止癌细胞浸润肺组织。PAC-1体内抗肿瘤效果归因于激活procaspase-3和随后诱导凋亡, 与体外活性一致。				
临床实验	N/A				
特征	PAC-1是第一个使procaspase-3直接激活为caspase-3的小分子试剂。				

#### ➤ 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	表达Procaspase-3, 然后在大肠杆菌中纯化。不同浓度PAC-1加到96孔板中, 孔中为含90μl 50ng/ml procaspase-3的caspase实验buffer, 实验板在37°C下温育12小时。Caspase实验buffer中的10μl 2mM caspase-3肽底物乙酰Asp-Glu-Val-Asp-p-nitroanilide(Ac-DEVD-pNa)溶液加到每孔中。实验板在Spectra Max Plus 384孔酶标仪上405nm处每两分钟读数一次, 持续2小时。测定每孔的直线部分斜率, 且计算对照组激活的相对增高量。

细胞实验	
细胞系	U-937, HL-60, CRL-1872, ACHN, NCI-H226, Hs888Lu, Hs578Bst, MCF-10A, SK-MEL-5, BT-20, MDA-MB-231, UACC-62, SK-N-SH, B16-F10, Hs 578t, PC-12
浓度	溶于DMSO, 终浓度为~100 $\mu$ M
处理时间	72小时
方法	使用不同浓度PAC-1处理细胞72小时。加入MTS/PMS CellTiter 96细胞增殖检测试剂定量测定细胞死亡。实验板在37°C下温育约1小时(直到形成有色产物), 在490nm处测定吸光值。

动物实验	
动物模型	皮下注射ACHN细胞的卵巢切除的雌性无胸腺BALB/c( nu/nu)裸鼠, 皮下注射NCI-H226细胞的胸腺无胸腺 BALB/c裸鼠, 静脉注射NCI-H226细胞的雄性无胸腺BALB/c/-小鼠。
配制	与胆固醇混合, 制成3mm直径20mg(全部重量)的颗粒, 或者溶于24: 1植物油/DMSO的混合物。
剂量	~100mg/kg
给药方式	颗粒皮下移植或口服处理

➤ **参考文献:**

1. Putt KS, et al. Nat Chem Biol, 2006, 2(10), 543-550.
2. Peterson QP, et al. J Mol Biol, 2009, 388(1), 144-158.
3. Seervi M, et al. Cell Death Dis, 2011, 2, e207.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC4336-10mM	PAC-1 (Caspase激活剂)	10mM×0.2ml
SC4336-5mg	PAC-1 (Caspase激活剂)	5mg
SC4336-25mg	PAC-1 (Caspase激活剂)	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