

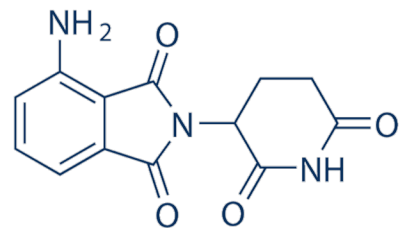
## Pomalidomide (TNF- $\alpha$ 抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4345-10mM	Pomalidomide (TNF- $\alpha$ 抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC4345-5mg	Pomalidomide (TNF- $\alpha$ 抑制剂)	5mg
SC4345-25mg	Pomalidomide (TNF- $\alpha$ 抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	4-amino-2-(2,6-dioxopiperidin-3-yl)isoindole-1,3-dione
简称	Pomalidomide
别名	S-3APG, Pomalyst, CC4047, CC 4047, CC-4047
中文名	泊马度胺
化学式	C <sub>13</sub> H <sub>11</sub> N <sub>3</sub> O <sub>4</sub>
分子量	273.24
CAS号	19171-19-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 55mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.83ml DMSO, 或每2.73mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4345-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Pomalidomide抑制LPS诱导的TNF- $\alpha$ 释放, 在PBMCs中IC <sub>50</sub> 为13nM。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	TNF- $\alpha$	—	—	—	—
IC <sub>50</sub>	13nM	—	—	—	—
体外研究	Pomalidomide抑制脂多糖(LPS)刺激的TNF- $\alpha$ 释放, 作用于人类 PBMC和人类全部血液时, IC <sub>50</sub> 分别为13nM和25nM。Pomalidomide抑制IL-2刺激的T调节细胞, IC <sub>50</sub> 为~1 $\mu$ M。6.4nM-10 $\mu$ M Pomalidomide处理人类外周血T细胞, 提高IL-2产量, 作用于CD4 <sup>+</sup> 子集比作用于CD8 <sup>+</sup> 子集有效。Pomalidomide比CC-5013显著促进IL-2、IL-5和IL-10, 比CC-5013稍微促进IFN- $\gamma$ 。Pomalidomide作用于Jurkat细胞, 增强SEE和Raji细胞诱导的AP-1转录活性, 1 $\mu$ M时最高增强4倍, 这种作用存在剂量依赖性。用不同浓度Pomalidomide(2.5-40 $\mu$ g/ml)处理Raji细胞48小时, 导致细胞增殖和DNA合成明显降低, 与对照组相比降低~40%。				
体内研究	Pomalidomide作用于SCID小鼠, 增强 Rituximab作用于B细胞淋巴瘤的抗癌效果。Pomalidomide和Rituximab联用使鼠平均寿命为74天, 与CC5013/Rituximab处理的鼠平均寿命为58天。NK细胞耗尽则Pomalidomide和Rituximab协同作用完全被废除, 说明NK细胞增多是Pomalidomide增强Rituximab抗癌的一个机制。				
临床实验	N/A				
特征	Pomalidomide是Thalidomide衍生物, 效果比Thalidomide强10000倍。				

#### ➤ 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	在内毒素(LPS)刺激的PBMC中测定TNF- $\alpha$ 抑制活性。Pomalidomide加到PBMCs中1小时, 然后加入LPS(1 $\mu$ g/ml), 再处理18-20小时。收集悬浮液, 通过ELISA测定悬浮液中的TNF- $\alpha$ 浓度。通过回归曲线分析计算IC <sub>50</sub> 值。人类全部血液TNF抑制实验和PBMC实验差不多, 除了肝素化的新鲜血液直接加到微量滴定法板上。

细胞实验	
细胞系	Raji, SU-DHL-4和SU-DHL-10细胞系
浓度	溶于DMSO, 终浓度为2.5-40 $\mu$ g/ml
处理时间	24或48小时

方法	为了测定细胞凋亡,用Pomalidomide(5µg/ml)处理淋巴瘤细胞系24小时或48小时。用FITC标记的膜联蛋白V和碘化丙啶进行细胞染色。使用荧光激活细胞分选仪/FACStar 和流式细胞仪,通过多色流式细胞仪分析细胞凋亡。如果膜联蛋白V阳性及碘化丙啶阴性/阳性,则判断为细胞凋亡(分布为凋亡早期和晚期)。为了测定细胞增殖,用Pomalidomide(2.5、5、10、20和40µg/ml)处理淋巴瘤细胞系24小时或48小时。在96孔板上,每孔加入1µCi [ <sup>3</sup> H]-胸苷,细胞再温育18小时。收集细胞,加到96孔玻璃过滤器中,然后使用自动闪烁计数器测定摄取的[ <sup>3</sup> H]-胸苷。
----	---

动物实验	
动物模型	携带扩散性淋巴瘤的SCID小鼠
配制	溶于DMSO,形成10mg/ml溶液,用0.9%无菌盐水稀释,终浓度为1mg/ml。
剂量	0.5mg/kg
给药方式	腹腔注射

➤ **参考文献:**

- 1.Muller GW, et al. Bioorg Med Chem Lett. 1999, 9(11), 1625-1630.
- 2.Galustian C, et al. Cancer Immunol Immunother. 2009, 58(7), 1033-1045.
- 3.Schafer PH, et al. J Pharmacol Exp Ther. 2003, 305(3), 1222-1232.
- 4.Hernandez-Ilizaliturri FJ, et al. Clin Cancer Res. 2005, 11(16), 5984-5992.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC4345-10mM	Pomalidomide (TNF-alpha抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4345-5mg	Pomalidomide (TNF-alpha抑制剂)	5mg
SC4345-25mg	Pomalidomide (TNF-alpha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