

Pirfenidone D5 (AMR69 D5)

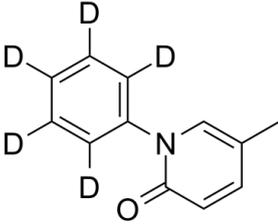
产品信息

| 产品名称 | 产品编号 | 规格 |
|---------------------------|-----------|------|
| Pirfenidone D5 (AMR69 D5) | 52933ES03 | 1 mg |
| | 52933ES08 | 5 mg |

产品描述

Pirfenidone D5 (AMR69 D5, AMR69D5, PirfenidoneD5) 是 Pirfenidone 的氘代物, 具有广谱抗纤维化和抗炎作用, 能降低神经胶质瘤细胞密度, 能抑制血清刺激的 DNA 合成和细胞增殖的增加。

产品性质

| | |
|------------------------|---|
| 英文别名 (English Synonym) | AMR69 D5; AMR69-D5; AMR69D5; Pirfenidone-D5; Pirfenidone-d5; PirfenidoneD5; 5-Methyl-N-phenyl-2-1H-pyridone-d5 (Pirfenidone-d5) |
| 中文名称 (Chinese Name) | 吡非尼酮-D5; 5-甲基-1-(苯基-2,3,4,5,6-D5)-2(1H)-吡啶酮 |
| 靶点 (Target) | TGF- β 2; CCL2; CCL12 |
| CAS 号 (CAS NO.) | 1020719-62-3 |
| 分子式 (Formula) | C ₁₂ H ₆ D ₅ NO |
| 分子量 (Molecular Weight) | 190.25 |
| 外观 (Appearance) | 粉末 |
| 纯度 (Purity) | ≥95% |
| 溶解性 (Solubility) | 溶于 DMSO |
| 结构式 (Structure) |  |

运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 2 年。溶于 DMSO。建议分装后-20°C避光保存, 避免反复冻融。

注意事项

- 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
- 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
- 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
- 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献, 并根据自身实验条件 (如实验目的, 细胞种类, 培养特性等) 进行摸索和优化。】

使用方法 (数据来自于公开发表的文献, 仅供参考)

(一) 细胞实验 (体外实验)

在 LN-18、T98G、LNT-229 和 LN-308 细胞系中, Pirfenidone (< 10 mM) 以浓度依赖性方式降低神经胶质瘤细胞密度。在 CCL-64 细胞中, Pirfenidone (< 5 mM) 通过影响 TGF- β 2 mRNA 表达和 pro-TGF- β 的加工而降低 TGF- β 生物活性。在 LN-308 细胞中, Pirfenidone (< 8.3 mM) 抑制重组弗林蛋白酶的活性, 并以剂量依赖性方式下调 MMP-11 的表达。^[1]

在培养的子宫肌层和平滑肌平滑肌细胞中, Pirfenidone 以剂量依赖性的方式抑制血清刺激的 DNA 合成和细胞增殖的增加。^[2]

将 CCL-64 细胞在不存在或存在 Pirfenidone D5 (1, 2.5, 5 mM) 的情况下产生的热活化 LN-308 条件培养基中培养 72 h。当以浓度依赖性方式暴露于 Pirfenidone D5 处理的细胞的 LN-308 上清液时, 归一化 CCL-64 细胞密度引起的吸光度增加, 结果表明用 Pirfenidone D5 处理 48 h 的 LN-308 细胞的上清液所含的生物活性 TGF- β 低于控制。用 Pirfenidone D5 (1, 2.5, 5 mM) 处理的 LN-308 细胞中 TGF- β 2 mRNA 水平的 RT-PCR 分析显示, 转录水平上 TGF- β 2 呈浓度依赖性降低。^[3]

(二) 动物实验 (体内实验)

吡非尼酮 (300 mg/kg/天) 给药 4 周。吡非尼酮显著降低博来霉素 (BLM) 治疗小鼠的评分 ($P < 0.0001$)。此外, 定量测定肺中胶原蛋白的含量以评价吡非尼酮的抗纤维化作用。与生理盐水或吡非尼酮处理的小鼠相比, BLM 处理的小鼠肺中的胶原含量显著增加, 并且在 BLM 处理后第 28 天施用吡非尼酮显著减弱了这种增加 ($P = 0.0012$)。^[4]

在腹膜内注射 50 μ g/kg 脂多糖和 250 mg/kg d-半乳糖胺之前, 雌性 C57BL/6 小鼠用 500mg/kg 吡非尼酮预处理 10 分钟。在脂多糖后 1.5 h 分离出 TNF- α , 白介素-6 和白细胞介素 10, 在脂多糖后 4.5 h 分离出干扰素-g, 用于细胞因子 mRNA 表达的 RT-PCR 分析, 结果显示: 吡非尼酮不会抑制脂多糖注射小鼠脾脏中的 TNF- α , 干扰素-g 和白细胞介素 6 mRNA 表达, 但会增强白细胞介素 10 mRNA 表达。^[5]

参考文献

- [1]. Burghardt I, et al. Pirfenidone inhibits TGF- β expression in malignant glioma cells[J]. Biochemical and biophysical research communications, 2007, 354(2): 542-547.
- [2]. Lee B S, et al. Pirfenidone: a novel pharmacological agent that inhibits leiomyoma cell proliferation and collagen production[J]. The Journal of Clinical Endocrinology & Metabolism, 1998, 83(1): 219-223.
- [3]. Isabel Burghardt, et al. Pirfenidone inhibits TGF- β expression in malignant glioma cells., 354(2), 0-547.
- [4]. Inomata M, et al. Pirfenidone inhibits fibrocyte accumulation in the lungs in bleomycin-induced murine pulmonary fibrosis. Respir Res. 2014 Feb 8;15: 16.
- [5]. Hitoshi Nakazato; Hisashi Oku; Shoji Yamane; Yuji Tsuruta; Ryuji Suzuki (2002). A novel anti-fibrotic agent pirfenidone suppresses tumor necrosis factor- α at the translational level., 446(1-3), 177-185.