

Posaconazole

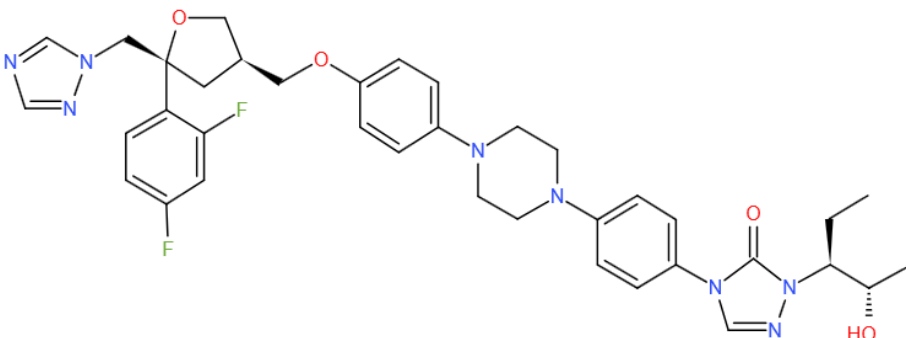
产品简介

Posaconazole (泊沙康唑; SCH 56592; Noxafil) 是一种抗真菌三唑化合物, 有效抑制各种真菌中的 14 α 去甲基化酶, 包括抑制念珠菌 (IC₅₀: 0.007-0.3 μ g/mL) 和曲霉 (IC₅₀: 0.03 μ g/mL)。Posaconazole 也是 CYP3A4 抑制剂, 但不抑制其他 CYP 酶的活性。同时, Posaconazole 还是 sterol C14 α demethylase 抑制剂 (IC₅₀: 0.25 μ M)。

产品信息

货号	54060ES08/ 54060ES10
规格	5 mg / 10 mg

产品性质

英文别名 (English Synonym)	SCH 56592; SCH56592; SCH-56592; POS; Noxafil
中文名称 (Chinese Name)	泊沙康唑
靶点 (Target)	lanosterol 14 α -demethylase; CYP3A4
通路 (Pathway)	Anti-infection--Fungal
CAS 号 (CAS NO.)	171228-49-2
分子式 (Formula)	C ₃₇ H ₄₂ F ₂ N ₈ O ₄
分子量 (Molecular Weight)	700.78
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO
结构式 (Structure)	

储存条件

-25~-15°C保存, 有效期 3 年。

注意事项

1. 为了您的安全和健康, 请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。

3. 避光干燥保存，避免反复冻融。
4. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
5. 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）

Posaconazole 具有强效杀锥虫活性。Posaconazole 会影响和破坏 *T. cruzi* 中 Ca^{2+} 的稳态。Posaconazole 阻断麦角甾醇的生物合成，麦角甾醇对寄生虫的存活至关重要。Posaconazole 对表鞭毛（细胞外）阶段的增殖呈现明确的剂量依赖性作用，最小抑制浓度为 20 nM， IC_{50} 为 14 nM。针对临床相关的细胞内无鞭毛体形式的寄生虫，Posaconazole 甚至更有效，最小的抑菌浓度和 IC_{50} 值分别为 3 nM 和 0.25 nM。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

Posaconazole (5, 15, 30 mg/kg; 口服给药; 每天两次; 7 天) 处理雄性 BALB/c 小鼠，结果显示 Posaconazole 处理小鼠的存活以剂量依赖性方式显著增加，并显著高于对照组。Posaconazole (30 mg/kg) 作用的存活率为 60 至 83%。Posaconazole (15, 30 mg/kg) 显著降低组织中的计数。^[2]

参考文献

- [1] Benaim G, et al. Amiodarone has intrinsic anti-Trypanosoma cruzi activity and acts synergistically with posaconazole. J Med Chem. 2006 Feb 9;49(3):892-9.
- [2] Sun Q N, et al. In vivo activity of posaconazole against Mucor spp. in an immunosuppressed-mouse model. Antimicrobial agents and chemotherapy, 2002, 46(7): 2310-2312.