

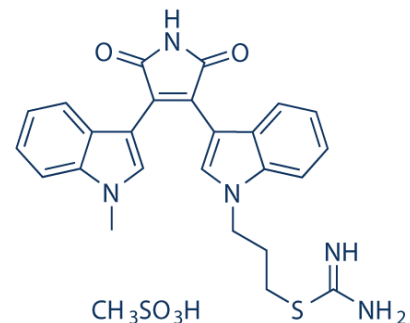
Ro 31-8220 (PKC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0344-10mM	Ro 31-8220 (PKC 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0344-5mg	Ro 31-8220 (PKC 抑制剂)	5mg
SC0344-25mg	Ro 31-8220 (PKC 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	methanesulfonic acid;3-[3-[4-(1-methylindol-3-yl)-2,5-dioxopyrrol-3-yl]indol-1-yl]propyl carbamimidothioate
简称	Ro 31-8220
别名	Ro 31-8220 methanesulfonate; Bisindolylmaleimide IX mesylate; o 31 8220; Ro 318220; Ro-31-8220; Ro31-8220; Bisindolylmaleimide IX
中文名	—
化学式	C ₂₅ H ₂₃ N ₅ O ₂ S·CH ₄ O ₃ S
分子量	553.65
CAS号	138489-18-6
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入0.90ml DMSO, 或者每5.54mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0344-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息

产品描述	Ro 31-8220 Mesylate是一种pan-PKC抑制剂, 作用于PKC- α , PKC- β I, PKC- β II, PKC- γ 和PKC- ϵ , IC50分别为5nM, 24nM, 14nM, 27nM和24nM, 也有效抑制MAPKAP-K1b, MSK1, GSK3 β 和S6K1。				
信号通路	PKC Signaling				
靶点	PKC α	PKC β 1	PKC β 2	PKC ϵ	PKC γ
IC50	5nM	24nM	14nM	24nM	27nM
体外研究	RO31-8220抑制大鼠脑蛋白激酶C活性, IC50为23nM, 在PKC- α , PKC- β , PKC- γ , PKC- ϵ 之间没有选择性。RO31-8220也抑制MSK1, MAPKAPK1, RSK, GSK3 β 和S6K1, 具有对PKC相似的效力。此外, RO31-8220抑制电压依赖性钠离子通道。RO31-8220改变细胞蛋白激酶C的定位并有效抑制A549细胞和MCF-7细胞的生长, IC50分别为0.78 μ M和0.897 μ M。在儿茶酚胺低反应血小板中, RO31-8220通过增强Akt的磷酸化增强了肾上腺素诱导的血小板聚集。通过抑制apoE基因的囊泡运输到质膜, RO31-8220显著降低载脂蛋白E从原代人巨噬细胞的分泌, 没有显著影响ApoE的mRNA水平或蛋白水平。				
体内研究	在mlP-/-小鼠体内, Ro 31-8220(6mg/kg/d, s.c.)导致心肌收缩力显著增加。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

➤ 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	测定混合物含有0.2mg/ml的 γ 肽, 10 μ M氯化镁, 0.6mM氯化钙, 10 μ M[[γ - ³² P]ATP, 1.25mg/ml的磷脂酰丝氨酸和1.25ng/ml在20mM HEPES(pH值7.5)中的佛波醇12-肉豆蔻酸酯13-乙酯, 2mM EDTA, 1mM的二硫苏糖醇及0.02%(重量/体积)的Triton X-100。 γ 肽是一种合成肽, GPRPLFCRKGSLRQKW, 类似PKC- γ 假底物位点, 不同的是一个丝氨酸残基替换的假底物丙氨酸, 将所述肽从抑制剂成substrat。测定是通过添加2.5m单位酶来启动, 在30°C温育10分钟, 并通过点样到P81纸终止, 接着在75mM的磷酸中充分洗涤。该纸再用乙醇洗涤, 干燥, 和结合的放射性通过liquidscintillation光谱测定。

细胞实验	
细胞系	人肺腺癌A549和MCF-7乳腺癌细胞
浓度	2.5μM
处理时间	24-48小时
方法	人肺腺癌A549和MCF-7乳腺癌细胞是从动物细胞培养欧洲保藏中心(ATCC)获得。细胞(传代次数10-30)在5%二氧化碳培养箱中进行培养,前者在含青霉素/链霉素的Ham氏F-12培养基中培养,后者在含丙酮酸(1毫摩尔)和非必需氨基酸的最小必需培养基(Eagle修改)中培养。两种培养基均补充有10% FCS和谷氨酰胺(2毫摩尔)。细胞传代培养每周两次以保持对数增长。对细胞增殖的研究,细胞接种和培养用3ml包含试剂的培养基,其中被补充以48小时(A549)或72小时(MCF-7)的时间间隔。在药物温育4天(A549)或6天(MCF-7)后,细胞数目用Coulter计数器ZM评估。为了实现PKC耗竭,细胞温育在bryostatin 1(1μM)中24小时。在这些条件下bryostatin1所造成的生长抑制是微不足道的。bryostatin在细胞2小时恢复期后充分洗涤除去。在以往使用A549细胞的研究中,该洗涤过程已被证明可减少bryostatin介导的效应。然后将细胞温育与staurosporine, RO 31-8220, UCN-01或H-7再温浴24小时。在一些实验中细胞与抑制剂孵育48小时而不是24小时,在此情况下bryostatin并未除去并留在温育液中。去除抑制剂后,抑制DNA合成是由 ³ H]Tdr掺入细胞的测定进行评价。放射性用Packard 1500 Tricarb闪烁计数器中计数。

动物实验	
动物模型	mIP-/-Mice
配制	N/A
剂量	6mg/kg/d
给药方式	s.c.

➤ 参考文献

1. Wilkinson SE, et al. Biochem J. 1993, 294 (Pt 2), 335-337.
2. Davies SP, et al. Biochem J. 2000, 351(Pt 1), 95-105.
3. Courage C, et al. Br J Cancer. 1995, 71(4), 697-704.
4. Kim SY, et al. BMB Rep. 2011, 44(2), 140-145.
5. Karunakaran D, et al. J Biol Chem. 2013, 288(7), 5186-5197.
6. Hambleton M, et al. Circulation. 2006, 114(6), 574-582.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0344-10mM	Ro 31-8220 (PKC抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0344-5mg	Ro 31-8220 (PKC抑制剂)	5mg
SC0344-25mg	Ro 31-8220 (PKC抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20℃保存,至少一年有效。5mg和25mg包装也可室温保存,至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂,建议分装后-80℃保存,预计6个月内有效。

注意事项:

- 本产品可能对人体有一定的毒害作用,请注意适当防护,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降于管底后再开盖使用。
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、体内研究结果或其它相关文献,或者根据实验目的,以及所培养的特细胞和组织,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:
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.06.04