

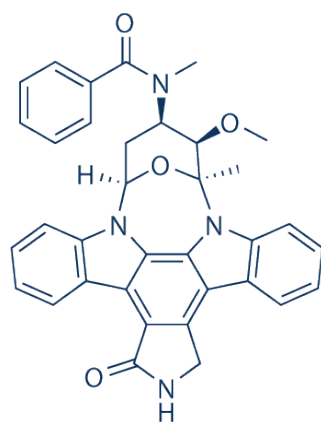
PKC412 (PKC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0375-10mM	PKC412 (PKC 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0375-5mg	PKC412 (PKC 抑制剂)	5mg
SC0375-25mg	PKC412 (PKC 抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	Benzamide, N-[(9S,10R,11R,13R)-2,3,10,11,12,13-hexahydro-10-methoxy-9-methyl-1-oxo-9,13-epoxy-1H,9H-diindolo[1,2,3-gh:3',2',1'-lm]pyrrolo[3,4-j][1,7]benzodiazonin-11-yl]-N-methyl-
简称	PKC412
别名	CGP41231; CGP41251; Midostaurin; PKC 412; PKC-412; CGP 41231; CGP 41251; 4'-N-benzoyl staurosporine; 4'-N-benzoylstaurosporine; benzoylstaurosporine
中文名	—
化学式	C ₃₅ H ₃₀ N ₄ O ₄
分子量	570.64
CAS号	120685-11-2
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 100mg/ml; Ethanol 100mg/ml
溶液配制	5mg加入0.88ml DMSO, 或者每5.71mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0375-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息

产品描述	Midostaurin (PKC412)是一种多靶点激酶抑制剂, 作用于PKC $\alpha/\beta/\gamma$, Syk, Flk-1, Akt, PKA, c-Kit, c-Fgr, c-Src, FLT3, PDRF β 和VEGFR1/2, IC50为80-500nM。				
信号通路	PKC Signaling				
靶点	PKC α	PKC β 1	PKC β 2	PKC γ	PPK
IC50	22nM	30nM	31nM	24nM	38nM
体外研究	Midostaurin (pkc412)是一种广谱的蛋白激酶抑制剂。Midostaurin(pkc412)强烈与常规PKC- α , - β 和- γ , PDGFR β , VEGF-R2, VEGF-R1, 及CDK 1-cyclin B复合物的ATP结合位点相互作用。Midostaurin(pkc412)在相似的亚微摩尔浓度时, 在体外抑制多种人类和动物细胞系的生长。Midostaurin(pkc412)在体外也有效抑制胶质母细胞瘤增殖, 且诱导细胞在G2/M期累积, 并形成巨核, 具有广泛的碎片和凋亡小体。Midostaurin(pkc412)在体外能够逆转肿瘤细胞中p-糖蛋白介导的多药耐药性。				
体内研究	Midostaurin (pkc412)除了直接抑制肿瘤细胞增殖(通过作用于PKCs), 还通过抑制肿瘤血管生成(通过作用于VEGF受体酪氨酸激酶)来抑制肿瘤的生长。Midostaurin (pkc412)与细胞毒性剂, 包括Doxorubicin, Cyclophosphamide, Cisplatin和Gemcitabine协同作用, 产生的抗血管生成作用可能有助于抗转移和广泛的抗肿瘤活性。Midostaurin (pkc412)口服给药, 最大耐受剂量为300mg/kg以上。				
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	N/A
细胞实验	
细胞系	A549, NCI-H520

浓度	~1.0 μ M
处理时间	24-72小时
方法	每孔加入5mM WST-1和0.2mM 1-甲氧基PMS，然后使用酶标仪在450nm处测量吸光度。

动物实验	
动物模型	Colo 205结肠移植瘤
配制	无菌水
剂量	50mg/kg, 200mg/kg, 每天一次
给药方式	口服处理

➤ 参考文献

1. Fabbro D, et al. Pharmacol Ther, 1999, 82(2-3), 293-301.
2. Ikegami Y, et al. Jpn J Pharmacol, 1996, 70(1), 65-72.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC0375-10mM	PKC412 (PKC抑制剂)	10mM \times 0.2ml
SC0375-5mg	PKC412 (PKC抑制剂)	5mg
SC0375-25mg	PKC412 (PKC抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

保存条件:

-20 $^{\circ}$ C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 $^{\circ}$ C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、体内研究结果或其它相关文献，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：
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.06.04