

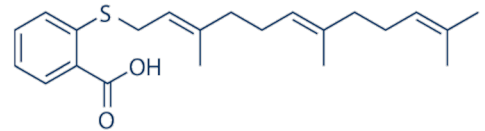
Salirasib (Rho抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC6596-10mM	Salirasib (Rho抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6596-5mg	Salirasib (Rho抑制剂)	5mg
SC6596-25mg	Salirasib (Rho抑制剂)	25mg

产品简介:

➤ 化学信息:

化学名	2-[(2E,6E)-3,7,11-trimethyldodeca-2,6,10-trienyl]sulfanylbenzoic acid
简称	Salirasib
别名	Farnesylthiosalicylic acid, S-farnesylthiosalicylic acid, S-trans, Trans-farnesylthiosalicylic acid,
中文名	N/A
化学式	C ₂₂ H ₃₀ O ₂ S
分子量	358.54
CAS号	162520-00-5
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 40mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.39ml DMSO, 或每3.59mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC6596-10mM用DMSO配制。



➤ 生物信息:

产品描述	Salirasib是一种有效的竞争性prenylated protein methyltransferase (PPMTase)抑制剂, Ki为2.6μM, 其抑制Ras甲基化。Phase 2。			
信号通路	Cell Cycle			
靶点	PPMTase	—	—	—
IC50	2.6μM(Ki)	—	—	—
体外研究	Salirasib抑制人Ha-ras转化的Rat1细胞生长, 这与它们对PPMTase的抑制良好相关。Salirasib抑制Rat-1成纤维细胞, Ras转化的Rat-1, 以及B16黑色素瘤细胞中Ras甲基化。Salirasib也会降低细胞膜中Ras水平, 并抑制Ras依赖性细胞生长, 其独立于甲基化, 但是由Ras-Raf通讯调节。在Ras转化的EJ细胞中, Salirasib干扰Raf-1和MAPK活化, 并抑制DNA合成。			
体内研究	在Panc-1异种移植的裸鼠体内, Salirasib(5mg/kg i.p.)显著抑制肿瘤生长, 而没有全身毒性。在雄性Wistar大鼠体内, Salirasib(5mg/kg i.p.)显著抑制硫代乙酰胺诱导的肝硬化。在先天性肌营养不良的dy(2J)/dy(2J)小鼠模型中, Salirasib(5mg/kg i.p.)减弱纤维化, 并提高肌肉力量。			
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	大鼠小脑突触体膜或培养细胞系的总膜(100000×g沉淀)用于无细胞体系中甲基转移酶测定。甲基转移酶在总体积为50μl的50mM Tris-HCl缓冲液中, pH 7.4, 使用100μg蛋白质, 25μM [methyl- ³ H]AdoMet(300000cpm/nmol)和50μM AFC(在DMSO中以原液制备), 于37°C下进行测定。所有试验的DMSO浓度为8%。不同AFC浓度按照指示用于各实验中。加入500μl氯仿: 甲醇(1:1)10分钟后, 终止反应, 随后加入250μl H ₂ O, 混合, 并相分离。氯仿相的125μl部分在40°C下干燥, 并加入200μl的1N NaOH和1% SDS溶液。因此形成的甲醇通过气相平衡法计算。典型的背景计数(无AFC添加)为50-100cpm, 而与AFC的典型反应产生500-6000cpm。试验以一式三份进行, 减去背景计数。使内源性底物甲基化, 并进行凝胶电泳。完整细胞中的蛋白质羧基甲基化使用100μCi/ml [methyl- ³ H]甲硫氨酸测定。细胞近似铺满培养基, 在含有5ml标记培养基的10cm板中生长测定。

细胞实验	
细胞系	PC12, CHE, T抗原转化的CHE, 内皮细胞, 星形胶质细胞, B16, Rat1, EJ, NIH3T3, v-Raf转化的NIH3T3细胞系
浓度	~100μM
处理时间	10天
方法	细胞在24孔板中生长。接种2小时后, 将细胞中加入溶剂或从原液中新鲜制备的FTS, 以得到在0.1% DMSO中的最终指示浓度。培养基每4天用包含溶剂或药物的新鲜培养基取代。分离实验表明溶剂本身对细胞生长没有作用。在指示期间, 细胞通过台盼蓝/EDTA从板上分离, 并在光学显微镜下计数。所有试验以一式四份进行。在平行实验中, 细胞用台盼蓝或MTT着色, 着色的细胞在光学显微镜下检查。在一些MTT染色的培养基中, 细胞溶解在0.2ml 100% DMSO中, 染色程度使用酶联免疫吸附测定阅读器分光光度法测定。

动物实验	
动物模型	Panc-1异种移植的裸鼠
配制	乙醇
剂量	每天5mg/kg
给药方式	i.p.

➤ 参考文献:

1. Marciano D, et al. J Med Chem. 1995, 38(8), 1267-1272.
2. Marom M, et al. J Biol Chem. 1995, 270(38), 22263-22270.
3. Gana-Weisz M, et al. Biochem Biophys Res Commun. 1997, 900-904.
4. Weisz B, et al. Oncogene. 1999, 18(16), 2579-2588.
5. Reif S, et al. J Hepatol. 1999, 31(6), 1053-1061.
6. Nevo Y, et al. PLoS One. 2011, 6(3), e18049.

包装清单:

产品编号	产品名称	包装
SC6596-10mM	Salirasib (Rho抑制剂)	10mM×0.2ml
SC6596-5mg	Salirasib (Rho抑制剂)	5mg
SC6596-25mg	Salirasib (Rho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