

雷帕霉素；西罗莫司；Rapamycin；Sirolimus

产品编号：MB1197

质量标准：≥98%

包装规格：25MG;100MG;1G

产品形式：solid

基本信息

分子式	C51H79NO13	结 构 式	
分子量	914.18		
CAS No.	53123-88-9		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO: 20 mg/mL		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

物理性状及指标：

外观：.....Off-white to yellow crystalline powder

溶解性：.....DMSO: 20 mg/mL

密度：.....1.18 g/cm³ (预测)

干燥失重：.....≤0.5%

IC50：.....人体外周血液单核细胞增殖：IC50 = 1 nM；白细胞介素-2 激活淋巴细胞：IC50 = 5 pM；

.....FK506 结合蛋白质 12：IC50 = 0.1 nM (Homo sapiens)；

.....半数致死剂量 (LD50) 经口 - 老鼠 -> 2,500 mg/kg

生物活性

产品描述	Rapamycin (Sirolimus)是一种特定的 mTOR 抑制剂，在 HEK293 细胞中，IC50 为 ~0.1 nM。
------	---

靶点	mTOR (HEK293 cells) ~0.1 nM
体外研究	Rapamycin 作用于 HEK293 细胞, 抑制内源性 mTOR 活性, IC50 为~0.1 nM, 而 iRap 和 AP21967 作用时, IC50 分别为~5 nM 和~10 nM。Rapamycin 处理酿酒酵母, 诱导细胞周期停在 G1/S 期, 且抑制翻译。Rapamycin 显著抑制 T98G 和 U87-MG 细胞活力, 这种作用具有剂量依赖性, IC50 分别为 2 nM 和 1 μM, 而对 U373-MG 细胞没有作用活性, IC50>25 μM。Rapamycin(100 nM) 作用于对 Rapamycin 敏感的 U87-MG 和 T98G 细胞, 通过抑制 mTOR 功能, 而诱导细胞周期停在 G1 期, 也诱导自噬而不是凋亡。
体内研究	在体内, Rapamycin 处理, 特定阻断 mTOR 下游靶点, 如 p70S6K 磷酸化和激活, 和 PHAS-1/4E-BP1 导致的 eIF4E 抑制释放, 完全阻断肌肉重量和纤维尺寸的肥厚增高。短期 Rapamycin 处理, 即使按最低剂量 0.16 mg/kg 处理, 强抑制 p70S6K 活性, 与提高的肿瘤细胞死亡和 Eker 肾脏肿瘤坏死相关。Rapamycin 作用于 CT-26 移植瘤模型, 通过降低 VEGF 产量, 及阻断 VEGF 诱导的内皮细胞信号, 而抑制转移性肿瘤生长和血管新生。Rapamycin 每天按 4 mg/kg 剂量处理 C6 移植瘤, 显著降低肿瘤生长, 和肿瘤血管通透性。

美仑相关产品推荐

MB1197-S	Rapamycin(Sirolimus) (标准品)
----------	----------------------------

用途及描述: 科研试剂, 广泛应用于分子生物学, 药理学等科研方面, 严禁用于人体。雷帕霉素(西罗莫司)是新型大环内酯的抗排斥药物, 是目前世界上最新的强效免疫抑制剂。本品抑制由抗原和细胞因子(白介素 IL-2、IL-4 和 IL-15)激发的 T 淋巴细胞的活化和增殖, 它亦抑制抗体的产生。在细胞中, 西罗莫司与免疫嗜素, 即 FK 结合蛋白-12 (FKBP-12) 结合, 生成 FKBP-12 免疫抑制复合物。此复合物与哺乳动物的西罗莫司 BA 分子 (mTOR, 一种关键的调节激酶) 结合并抑制其活性, 从而抑制细胞周期中 G1 期向 S 期的发展。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.0939 mL	5.4694 mL	10.9388 mL
5 mM	0.2188 mL	1.0939 mL	2.1878 mL
10 mM	0.1094 mL	0.5469 mL	1.0939 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>mTOR 激酶免疫印迹法测定:</p> <p>HEK293 细胞按每孔 2-2.5×10⁵ 个细胞接种在 12 孔板上, DMEM 培养基上血清饥饿处理 24 小时。使用浓度不断增加的 Rapamycin(0.05-50 nM)在 37°C 下处理细胞 15 分钟。加入血清, 终浓度为 20%, 在 37°C 下处理 30 分钟。细胞溶解, 使用 SDS-PAGE 分离细胞裂解液。再溶解的蛋白转移到聚偏(二)氟乙烯膜上, 使用抗 p70 S6 激酶 Thr-389 的磷酸化的一抗进行免疫印迹。使用 ImageQuant 和 KaleidaGraph 分析数据。</p>
-------------	---

<p>细胞实验</p>	<p>Cell lines: U87-MG, T98G, 和 U373-MG Concentrations: 溶于 DMSO,终浓度为~25 μM Incubation Time: 72 小时 Method: 使用不同浓度 Rapamycin 处理细胞 72 小时。为了测量细胞活力, 通过胰蛋白酶化收集细胞, 使用台酚蓝染色, 计数每孔的存活细胞数。为了测定细胞周期, 使细胞胰蛋白酶化,与 70%乙醇混合, 使用碘化丙啶染色。使用 FACScan 流式细胞仪和 CellQuest 软件分析样本 DNA 含量。为了测定凋亡, 细胞染色, 通过末端脱氧核苷酸转移酶调节的 dUTP 缺口末端标记法 (TUNEL) 技术, 使用一个 ApopTag 凋亡检测试剂盒对细胞进行染色。为了测定酸性囊泡细胞器(AVO)的进展,使用吖啶橙(1 μg/mL)对细胞进行染色 15 分钟, 使用荧光显微镜检测。为了量化 AVOs 的进展,使用吖啶橙(1 μg/mL) 对细胞进行染色 15 分钟, 然后使用胰蛋白酶-EDTA 使其从实验板上移除, 最后使用 FACScan 流式细胞仪和 CellQuest 软件分析。为了分析自噬过程, 细胞和 0.05 mM 丹(磺)酰戊二胺(MDC)在 37oC 下温育 10 分钟, 然后在荧光显微镜下观察。</p>
<p>动物实验</p>	<p>Animal Models: 皮下接种表达 VEGF-A 的 C6 大鼠胶质瘤细胞的无胸腺 Nu/Nu 小鼠 Dosages: ~4 mg/kg/day Administration: 腹腔注射</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装, 若用于细胞培养, 请提前做预处理, 除去热原细菌, 否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息, 我司不保证所提供信息的权威性, 以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装: 您收到货物后最好不要自己进行分包, 因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质; 如您有特殊包装要求, 请在订购时候与我们客服代表阐明, 当然价格会做适当调整。对于开盖后, 长期未使用的, 请务必重新密封好, 建议 Parafilm 封口膜, 并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长, 超过产品有效期, 建议您重新购买, 以免影响实验质量。

2 储备液制备: 大部分试剂的溶液形式稳定性较差, 请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液, 请选用合适溶剂, 细胞培养类多选择 DMSO, 储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存, 一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前, 再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备: 请根据个人需要正确计算浓度, 稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的, 所以使用水性溶剂 (如 PBS) 稀释时, 可能会析出沉淀, 可通过超声使固体重新溶解, 不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂, 请确保 DMSO 最终使用浓度<0.3%, 以避免细胞毒性。

灭菌方式, 我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌, 请勿采用紫外, 射线或者高温灭菌方式, 否则会影响化合物活性, 甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用: 由于很多化合物是脂溶性的, 动物实验工作液配制失活, 可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂, 如吐温, CMC-NA, 甘油等, 具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO, 请确

保 DMSO 的终浓度<5%,以避免毒性作用。给药剂量设计时候,可以参考下表
 动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后,请及时查验产品的包装完整性,并对数量进行确认。对于很多微量的产品,数量低于 500MG 的,我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置,从而导致产品附着在管壁或者盖子上,这时候请不要先打开盖子,需正位放置轻轻拍打,使产品沉降到管底。对于液体产品,可以在 200 转左右稍作离心,管底收集液体,从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差,在下面范围内均属于我司正常范围,望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的,如果您购买的产品的量非常小,同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层,可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂(参照操作手册)并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量,我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物;对于具有吸湿性的化合物,暴露在空气中会吸收水分,呈现液滴状,这种产品需要放置在干燥器中保存。