

Ruboxistaurin HCl(LY333531)

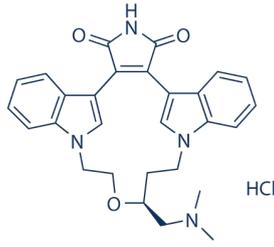
产品编号: MB3594

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5mg

产品形式: solid

基本信息

分子式	C28H28N4O3.HCl	结 构 式	
分子量	505.01		
CAS No.	169939-93-9		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble DMSO: 50 mg/mL (99.01 mM) Ethanol: Insoluble		
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。		

简介: LY333531 是特异性β-蛋白激酶 C 的抑制剂。能竞争性地、可逆地抑制 PKCβ1 和 PKCβ2, IC50 分别为 4.7 和 5.9 nM。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:H2O : Insoluble; Ethanol: Insoluble; DMSO: 50 mg/mL (99.01 mM)

含量:>98%

储存温度: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

描述	LY333531 是特异性β-蛋白激酶 C 的抑制剂。能竞争性地、可逆地抑制 PKCβ1 和 PKCβ2, IC50 分别为 4.7 和 5.9 nM。				
IC50 & Target	PKCβ1 (Cell-free assay)	PKCβ2 (Cell-free assay)	PKCη (Cell-free assay)	PKCδ (Cell-free assay)	PKCγ (Cell-free assay)
	4.7 nM	5.9 nM	0.052 μM	0.25 μM	0.3 μM
体外	LY333531 显著地降低 HUVEC 细胞生存机会, 相较于 AGEs 组, LY333531 对 HUVEC 的凋亡性细胞死亡的效果显著增加。抑制 PKC-beta 可上调 Bax 和 Bad 蛋白表达水平、下调 Bcl-2 蛋白表达水平。此外, LY333531 降低了 Bcl-2/Bax 的比值。它能够促进 AGEs 诱导的内皮细胞凋亡。Bax、Bad 表达的上调和 Bcl-2、Bcl2/Bax 比值的降低都与凋亡过程相关。				
体内	在 streptozotocin 诱导的糖尿病大鼠中, 4 周的 LY333531 处理能够阻止 PKCβ2 的过度激				

	活，缓解心脏舒张功能不全障碍。LY333531 抑制心肌 NO、Cav-2、p-AKT、p-eNOS 的表达下降以及减少 O2-、nitrotyrosine、Cav-1、iNOS 的表达增加。
细胞实验	<p>Cell lines: 人脐静脉内皮细胞(HUVEC)</p> <p>Concentrations: 200 nM</p> <p>Incubation Time: 48 h</p> <p>Method: 将 HUVEC 细胞接种于 96 孔板，用低糖的 DMEM 培养基（含 10%FBS）培养 12 小时，血清饥饿处理 HUVECs 12 小时，然后加入 BSA (200 µg/ml)或 AGEs (200 µg/ml)或 LY333531 (200 nM)+AGEs (200 µg/ml)处理 48 小时。然后，将培养基换为 0.5 mg/ml MTT，在 37℃，5% CO2 条件下置于细胞培养箱培养 4 小时。吸走含 MTT 的培养基，换成 DMSO。测定 OD 值。AGEs:糖基化终末产物。 (Only for Reference)</p>

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB2672	Valrubicin
MB3596	Midostaurin (PKC412)
MB4055	Enzastaurin (LY317615)

储液配置及储存：按表中溶解性配置；如溶解困难，可以通过快速搅拌，超声或温和加热（在 45-60℃ 下水浴）。液体稳定性报道的很少，建议现配现用，如需储存，建议：-20℃ 1-3 月；-80℃ 3-6 月。

体 积 浓度	DMSO 质量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9802 mL	9.9008 mL	19.8016 mL
5 mM	0.3960 mL	1.9802 mL	3.9603 mL
10 mM	0.1980 mL	0.9901 mL	1.9802 mL
50 mM	0.0396 mL	0.1980 mL	0.3960 mL

【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。