

### Midostaurin (PKC412)

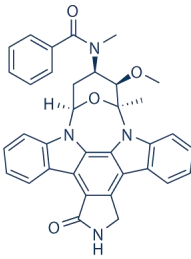
产品编号: MB3596

质量标准: >98%,BR

包装规格: 1mg/5mg

产品形式: solid

#### 基本信息

分子式	C35H30N4O4	结构式	
分子量	570.64		
CAS No.	120685-11-2		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	H2O : Insoluble DMSO: 100 mg/mL (175.24 mM) Ethanol: 39 mg/mL (68.34 mM) (warmed with 50℃ water bath)		
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:** 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, PDGFR $\beta$ 和 VEGFR1/2, IC50 为 80-500 nM。

#### 物理性状及指标:

外观: .....粉末

溶解性: .....H2O : Insoluble; Ethanol: 39 mg/mL (68.34 mM) (warmed with 50℃ water bath); DMSO: 100 mg/mL (175.24 mM)

含量: .....>98%

**储存温度:** -20℃, 避光防潮密闭干燥

#### 生物活性

<b>描述</b>	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, PDGFR $\beta$ 和 VEGFR1/2, IC50 为 80-500 nM。					
<b>IC50 &amp; Target</b>	PKC $\alpha$ (Cell-free assay)	PKC $\gamma$ (Cell-free assay)	PKC $\beta$ 1 (Cell-free assay)	PKC $\beta$ 2 (Cell-free assay)	PPK (Cell-free assay)	
	22 nM	24 nM	30 nM	31 nM	38 nM	
<b>体外</b>	Midostaurin(pkc412)是一种广谱的蛋白激酶抑制剂。Midostaurin(pkc412)强烈与常规 PKC- $\alpha$ , - $\beta$ 和 - $\gamma$ , PDGFR $\beta$ , VEGF-R2, VEGF-R1, 及 CDK 1-cyclin B 复合物的 ATP 结合位点相互作用					

	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	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 300 mg/kg 以上。
细胞实验	Cell lines: A549, NCI-H520 Concentrations: ~1.0 $\mu$ M Incubation Time: 24-72 小时 Method: 每孔加入 5 mM WST-1 和 0.2 mM 1-甲氧基 PMS，然后使用酶标仪在 450nm 处测量吸光度。 (Only for Reference)
动物实验	Animal Models: Colo 205 结肠移植瘤 Formulation: 无菌水 Dosages: 50 mg/kg, 200 mg/kg, 每天一次 Administration: 口服处理 (Only for Reference)

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
MB3594	Ruboxistaurin HCl(LY333531 )
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°C 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°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

浓度	DMSO 质量 / 体积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7524 mL	8.7621 mL	17.5242 mL
5 mM	0.3505 mL	1.7524 mL	3.5048 mL
10 mM	0.1752 mL	0.8762 mL	1.7524 mL
50 mM	0.0350 mL	0.1752 mL	0.3505 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，请选择合适溶剂，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。