

## Enzastaurin (LY317615)

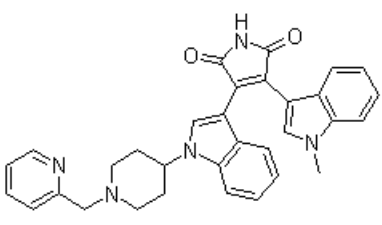
产品编号: MB4055

质量标准: >98%, PKC β 选择性抑制剂

包装规格: 10MG;50MG;200MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C32H29N5O2	结 构 式	
分子量	515.61		
CAS No.	170364-57-5		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25° C)	DMSO: 30 mg/mL (58.18 mM) Water Insoluble 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:** Enzastaurin 是一种有效的 PKC β 抑制剂, 对其选择性是对 PKC α, PKC γ 和 PKC ε 的 6-20 倍。

**别名:** 恩扎妥林; LY317615; 1H-Pyrrole-2,5-dione,

3-[1-(methyl-1H-indol-3-yl)-4-[1-[1-(2-pyridinylmethyl)-4-piperidinyl]-1H-indol-3-yl]-

### 物理性状及指标:

外观: .....橙色粉末

溶解性: .....DMSO: 30 mg/mL (58.18 mM); Water Insoluble; Ethanol Insoluble

含量: .....>98%

储存条件: -20°C, 避光防潮密闭干燥

### 生物活性

<b>产品描述</b>	Enzastaurin (LY317615) 是有效的 PKC β 选择性抑制剂, IC50 为 6 nM, 比作用于 PKC α, PKC γ 和 PKC ε 选择性高 6 到 20 倍。			
<b>靶点</b>	PKC β	PKC α	PKC γ	PKC ε
<b>IC50</b>	6 nM	39 nM	83 nM	110 nM
<b>体外研究</b>	Enzastaurin 阻断 U87MG 恶性胶质瘤细胞, PC-3 前列腺癌细胞, 及 HCT116 结肠癌细胞的增殖。当 Enzastaurin 浓度低于 1 μM 时则可能对 HCT116 和 U87MG 细胞有温和的诱导。Enzastaurin 阻断许多细胞系如 K-562, MOLT-4, HOP-92, 和 PC-3 细胞系的增殖。当 Enzastaurin 浓度为 4 μM 时可诱导 HCT116 结肠癌细胞和 U87MG 恶性胶质瘤细胞凋亡。Enzastaurin 诱导 HCT116 结肠癌细胞凋亡存在剂量依赖性, 用 4 μM Enzastaurin 处理 HCT116 细胞使 TUNEL 阳性细胞从基础水平 2% 涨到 50% 以上。活体研究显示, Enzastaurin 明显阻断 HCT116 结肠癌细胞和 U87MG 恶性胶质瘤细胞的生长。Enzastaurin 皮肤 T 细胞淋巴瘤的恶性淋巴细胞凋亡。Enzastaurin 和 GSK3 抑制剂联用, 提高细胞			

	毒性水平。Enzastaurin 和 GSK3 抑制剂 AR-A014418 联用提高 $\beta$ -catenin 蛋白水平和 $\beta$ -catenin 调节的转录水平。Enzastaurin 和 AR-A014418 联用阻断 $\beta$ -catenin 调节的转录。此外，Enzastaurin 和 AR-A014418 联用提高 mRNA 水平，及 CD44 表达。
体内研究	与单独使用相比，Enzastaurin 结合辐射对异种移植瘤的治疗使微血管的密度产生更大的降低。微血管密度的降低与肿瘤生长延缓相一致。

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)

MB4601	Go 6983
MB4599	Sotrastaurin

**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。Enzastaurin (LY317615) 是有效的 PKC  $\beta$  选择性抑制剂本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质 量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9395 mL	9.6973 mL	19.3945 mL
5 mM	0.3879 mL	1.9395 mL	3.8789 mL
10 mM	0.1939 mL	0.9697 mL	1.9395 mL
50 mM	0.0388 mL	0.1939 mL	0.3879 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p><b>激酶实验:</b> 使用滤板法测定髓鞘碱性蛋白基底 <math>^{33}\text{P}</math> 的渗透率，而测定用 Enzastaurin 阻断 PKC <math>\beta</math> II, PKC <math>\alpha</math>, PKC <math>\epsilon</math>, 或 PKC <math>\gamma</math> 的活性。在 96 孔板上加 100 <math>\mu\text{l}</math> 反应物进行反应，反应物包括 90 mM HEPES (pH 为 7.5), 0.001% Triton X-100, 4% DMSO, 5 mM <math>\text{MgCl}_2</math>, 100 <math>\mu\text{M}</math> <math>\text{CaCl}_2</math>, 0.1 mg/ml 磷脂酰丝氨酸, 5 <math>\mu\text{g/ml}</math> 二乙酰甘油, 30 <math>\mu\text{M}</math> ATP, 0.005 <math>\mu\text{Ci}/\mu\text{l}</math> <math>^{33}\text{ATP}</math>, 0.25 mg/ml 髓鞘碱性蛋白, enzastaurin 的连续稀释物 (浓度为 1-2,000 nM), 及重组人类 PKC <math>\beta</math> II, PKC <math>\alpha</math>, PKC <math>\epsilon</math>, 或 PKC <math>\gamma</math> 酶(分别为 390, 169, 719, 或 128 pM)。加入酶反应开始，在室温下温育 60 分钟，加入 10% <math>\text{H}_3\text{PO}_4</math> 结束反应，转移到多屏阴离子磷酸纤维素 96 孔滤板上，温育 30 到 90 分钟，过滤，在真空歧管用 4 体积的 0.5% <math>\text{H}_3\text{PO}_4</math> 冲洗。加入闪烁混合物，板在 Microbeta 闪烁计数器上读数。</p>
细胞实验	<p><b>Cell lines:</b> HCT116 和 U87MG 细胞系 <b>Concentrations:</b> 0.3-4 <math>\mu\text{M}</math> <b>Incubation Time:</b> 72 小时 <b>Method:</b> 通过核小体分裂和末端转脱氧核苷酰酶调节的缺口末端标记(TUNEL)法标记 HCT116 和 U87MG 细胞系，用于测定 Enzastaurin 的凋亡诱导率。在 96 孔板上每孔加 <math>5 \times 10^3</math> 个细胞 (添加 FBS 的条件培养基)，在有 (实验组) 或没有 (对照组) Enzastaurin 的环境下温育 48 到 72 小时。Enzastaurin 的浓度从 0.1 到 10 <math>\mu\text{M}</math> 不等。加入原位细胞凋亡检测，荧光试剂进行原位 TUNEL 染色。在 6 孔板上，每孔加 <math>75 \times 10^3</math> 个 HCT116 和 U87MG 细胞，在 1% 添加 FBS 的培养基 <math>\pm</math> Enzastaurin 环境下温</p>

	育 72 小时用 Epics 流式细胞仪测定荧光标记的 DNA 链断裂。收集 10x10 <sup>3</sup> FITC 染色的单细胞用于各项试验。
动物实验	<b>Animal Models:</b> 无胸腺裸鼠 <b>Formulation:</b> 溶于水的 10% 胶 <b>Dosages:</b> 75 mg/kg, 每天两次 <b>Administration:</b> 饲喂处理

**【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 (M <sup>2</sup> )	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。