

Bisindolylmaleimide IX Mesylate ; RO-31-8220 Mesylate

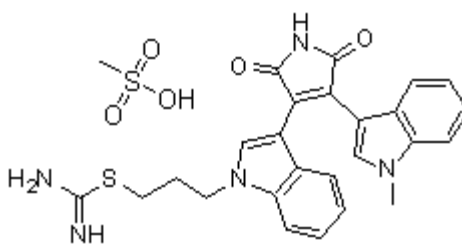
产品编号 : MB4108

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₅ H ₂₃ N ₅ O ₂ S·CH ₄ O ₃ S	结 构 式	
分子量	553.65		
CAS No.	138489-18-6		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (180.61 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 : Ro 31-8220 mesylate 是一种有效的 PKC 抑制剂, 也有效抑制 MAPKAP-K1b, MSK1, GSK3β 和 S6K1。

别名 : Ro 31-8220 methanesulfonate; Bisindolylmaleimide IX mesylate

物理性状及指标 :

外观 :类白色至橘色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (180.61 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

产品描述	Ro 31-8220 Mesylate 是一种 pan-PKC 抑制剂, 作用于 PKC-α, PKC-βI, PKC-βII, PKC-γ 和 PKC-ε, IC ₅₀ 分别为 5 nM, 24 nM, 14 nM, 27 nM 和 24 nM, 也有效抑制 MAPKAP-K1b, MSK1, GSK3β 和 S6K1。				
靶点	PKCα	PKCβ2	PKCβ1	PKCε	PKCγ
	5 nM	14 nM	24 nM	24 nM	27 nM

体外研究	RO31-8220 抑制大鼠脑蛋白激酶 C 活性，IC ₅₀ 为 23 nM，在 PKC- α ，PKC- β ，PKC- γ ，PKC- ϵ 之间没有选择性。RO31-8220 也抑制 MSK1，MAPKAPK1，RSK，GSK3 β 和 S6K1，具有对 PKC 相似的效力。此外，RO31-8220 抑制电压依赖性钠离子通道。RO31-8220 改变细胞蛋白激酶 C 的定位并有效抑制 A549 细胞和 MCF-7 细胞的生长，IC ₅₀ 分别为 0.78 μ M 和 0.897 μ M。在儿茶酚胺低反应血小板中，RO31-8220 通过增强 Akt 的磷酸化增强了肾上腺素诱导的血小板聚集。通过抑制 apoE 基因的囊泡运输到质膜，RO31-8220 显著降低载脂蛋白 E 从原代人巨噬细胞的分泌，没有显著影响 ApoE 的 mRNA 水平或蛋白水平。
体内研究	在 MLP-/-小鼠体内，Ro 31-8220 (6 mg/kg/d, s.c.)导致心肌收缩力显著增加。

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)

MB4055	Enzastaurin (LY317615)
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。Ro 31-8220 mesylate 是一种有效的 PKC 抑制剂，也有效抑制 MAPKAP-K1b，MSK1，GSK3 β 和 S6K1。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8062 mL	9.0310 mL	18.0620 mL
5 mM	0.3612 mL	1.8062 mL	3.6124 mL
10 mM	0.1806 mL	0.9031 mL	1.8062 mL
50 mM	0.0361 mL	0.1806 mL	0.3612 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>PKC 活性检测:</p> <p>测定混合物含有 0.2 mg/mL 的 γ 肽，10 μM 氯化镁，0.6 mM 氯化钙，10 μM[[γ-³²P]ATP，1.25 mg/mL 的磷脂酰丝氨酸和 1.25 ng / mL 在 20mM HEPES (pH 值 7.5) 中的佛波醇 12-肉豆蔻酸酯 13-乙酸酯，2 mM EDTA，1 mM 的二硫苏糖醇及 0.02% (重量/体积) 的 Triton X-100。γ 肽是一种合成肽，GPRPLFCRKGSLRQKW，类似 PKC-γ 假底物位点，不同的是一个丝氨酸残基替换的假底物丙氨酸，将所述肽从抑制剂成 substrat。测定是通过添加 2.5 m 单位酶来启动，在 30°C 温育 10 分钟，并通过点样到 P81 纸终止，接着在 75mM 的磷酸中充分洗涤。该纸再用乙醇洗涤，干燥，和结合的放射性通过</p>
-------------	--

	liquidscintillation 光谱测定。
细胞实验	<p>Cell lines: 人肺腺癌 A549 和 MCF-7 乳腺癌细胞</p> <p>Concentrations: 2.5 μM</p> <p>Incubation Time: 24-48 小时</p> <p>Method: 人肺腺癌 A549 和 MCF-7 乳腺癌细胞是从动物细胞培养欧洲保藏中心 (ATCC) 获得。细胞 (传代次数 10-30) 在 5% 二氧化碳培养箱中进行培养, 前者在含青霉素/链霉素的 Ham 氏 F-12 培养基中培养, 后者在含丙酮酸 (1 毫摩尔) 和非必需氨基酸的最小必需培养基 (Eagle 修改) 中培养。两种培养基均补充有 10%FCS 和谷氨酰胺 (2 毫摩尔)。细胞传代培养每周两次以保持对数增长。对细胞增殖的研究, 细胞接种和培养用 3ml 包含试剂的培养基, 其中被补充以 48 小时 (A549) 或 72 小时 (MCF -7) 的时间间隔。在药物温育 4 天 (A549) 或 6 天 (MCF-7) 后, 细胞数目用 Coulter 计数器 ZM 评估。为了实现 PKC 耗竭, 细胞温育在 bryostatin 1 (1 μM) 中 24 小时。在这些条件下 bryostatin1 所造成的生长抑制是微不足道的。bryostatin 在细胞 2 小时恢复期后充分洗涤除去。在以往使用 A549 细胞的研究中, 该洗涤过程已被证明可减少 bryostatin 介导的效应。然后将细胞温育与 staurosporine, RO 31-8220, UCN- 01 或 H- 7 再温浴 24 小时。在一些实验中细胞与抑制剂孵育 48 小时而不是 24 小时, 在此情况下 bryostatin 并未除去并留在温育液中。去除抑制剂后, 抑制 DNA 合成是由 [³H]Tdr 掺入细胞的测定进行评价。放射性用 Packard 1500 Tricarb 闪烁计数器中计数。</p>
动物实验	<p>Animal Models: MLP^{-/-} Mice</p> <p>Formulation: --</p> <p>Dosages: 6 mg/kg/d</p> <p>Administration: s.c</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。