

U-73122 ; U73122

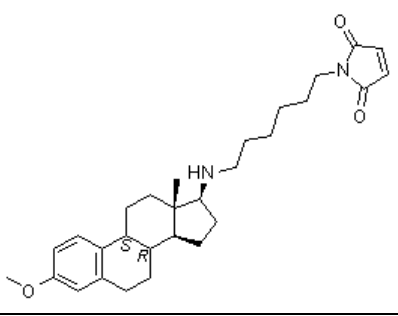
产品编号 : MB4319

质量标准 : >98%,BR

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C ₂₉ H ₄₀ N ₂ O ₃	结 构 式	
分子量	464.64		
CAS No.	112648-68-7		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 0.01 mg/mL warmed (0.02 mM)		
	Water : Insoluble		
	DMF : 24 mg/mL warmed (51.65 mM)		
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 : U-73122 (U73122) 是一种强效 phospholipase C (PLC)抑制剂。

别名 : 1H-Pyrrole-2,5-dione, 1-[6-[[[(17b)-3-methoxyestra-1,3,5(10)-trien-17-yl]amino]hexyl]-

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 0.01 mg/mL warmed (0.02 mM) ; Water : Insoluble ; DMF : 24 mg/mL warmed (51.65 mM)

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	U73122 是一种强效 phospholipase C (PLC)抑制剂, 能够减少激动剂诱导的血小板和中性粒细胞中 Ca ²⁺ 增加。
靶点	PLC
体外研究	U73122 显著抑制各种激动剂, 包括胶原蛋白, 凝血酶, ADP, 花生四烯酸诱导的人血小板的聚集, IC ₅₀ 为 1-5 μM。凝血酶或者 U-46619 通过抑制被血小板可溶组分催化的磷脂酰[3H]肌糖和磷脂酰[3H]肌糖 4,5-二磷酸的水解(Ki 分别为 9 和 40 μM), 诱导 IP ₃ 的产生和随后细胞溶质中 Ca ²⁺ 的快速增加, U-73122 (10 μM)会对其产生抑制。U-73122 抑制胶原蛋白诱导的

	<p>血栓素 B 的产生，胶原蛋白通过抑制受体耦合的花生四烯酸转移产生诱导作用。U73122 也会抑制 FMLP 诱导的人多形核中性白细胞聚合，以及相关的 IP3 和甘油二酯的产生。U-73122 剂量依赖性抑制 C5a, FMLP, PAF 和 LTB4 诱导的 MPO 和 B12-BP 从细胞松弛素 B 处理的 PMNs 中释放。MPO 释放的 IC50 值为 60 (FMLP), 110 (LTB4), 115 (C5a)和 120 (PAF) nM; B12-BP 释放的 IC50 值为 105 (FMLP), 110 (LTB4), 120 (C5a)和 140 (PAY) nM。U-73122 也是 C5a 或 FMLP 激活的细胞松弛素 B 处理的 PMNs 产生超氧阴离子的有效抑制剂, IC50 分别为 160 和 300 nM。U-73122 也会抑制 FMLP 刺激的 PMNs 中[Ca²⁺]_i, IP3 和 DAG 产生的增加, IC50 分别为 500 nM, 2 μM, 和 2 μM。3 μM U-73122 引起 FMLP 诱导的 GTPase 活性 100%被抑制。U-73122 浓度依赖性抑制 FMLP 诱发的, PKC 与可提取的 PMNs 颗粒部分的结合, 但不抑制 PMN PKC 的可溶制剂。U73122 显著抑制重组人 PLC-β2, IC50 为~6 μM。U73122 对 PLC-β1, PLC-β3, 或 PLC-β4 作用较弱。在人中性粒细胞中, U73122 减少白介素-8 和白三烯 B4-诱导的 Ca²⁺流和趋化性, IC50 分别为~6 μM 和 ~5 μM。在未分化的 NG108-15 细胞中, 1 μM U73122 阻断缓激肽(BK)诱导的细胞内自由 Ca²⁺浓度的增加。暴露 20 分钟的 IC50 大约为 200 nM。1 μM U73122 使[Ca²⁺]_i产生一个小但显著的增加, 这导致细胞内储存的 Ca²⁺释放。在分化的 NG108-15 细胞中, U73122 完全阻断去极化诱导的 Ca²⁺流。相反, 在 DRG 神经元中, U73122 仅轻微抑制电压敏感的 Ca²⁺通道。U73122 是 G 蛋白介导的胰腺泡中磷脂酶 C 激活的相对特异性抑制剂。U73122 在最大作用浓度 10 μM 下抑制磷脂酰肌醇(PI)对缩胆囊素(81%)或乙酰胆碱(73%)刺激的水解作用。在 fura-2 负载的腺泡中, U73122 (10 μM)抑制高浓度促分泌素刺激的[Ca²⁺]_i的增加。U73122 也会抑制氟化钠直接刺激 G 蛋白产生的[Ca²⁺]_i信号。U73122 快速抑制低浓度缩胆囊素或乙酰胆碱引起的振荡[Ca²⁺]_i信号。U73122 浓度和时间依赖性增加无细胞胶束系统中 hPLCβ3 的活性, 伴随酶活性高达 8 倍的增加, EC50 为 13.6 μM。U73122 对 hPLCβ3 的活化需要半胱氨酸的共价修饰。U73122 (10 μM)也会激活 hPLCγ1(>10 倍)和 hPLCβ2(~2 倍); PLC β1 不会被激活或抑制。</p>
体内研究	<p>U73122 (30 毫克/千克, 腹腔注射)阻断角叉菜胶处理 1 小时和 3 小时后大鼠后爪 65%和 80%的水肿。在狗体内, U73122 (0.1 毫克/毫升)分别抑制角叉菜胶诱导的 65%巨噬细胞和 74%淋巴细胞积累到皮下腔隙。U73122 (30 毫克/千克, 腹腔注射)完全抑制小鼠腹膜炎模型中 LPS 诱导的巨噬细胞和淋巴细胞浸润, 以及前列腺素 E2(80%), 并且也会抑制 12-O-十四酰-佛波醇-13-乙酸盐诱导的小鼠耳肿胀。</p>

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。本品 U-73122 (U73122) 是一种强效 phospholipase C (PLC)抑制剂。可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
浓度			
1 mM	2.1522 mL	10.7610 mL	21.5220 mL
5 mM	0.4304 mL	2.1522 mL	4.3044 mL
10 mM	0.2152 mL	1.0761 mL	2.1522 mL

50 mM	0.0430 mL	0.2152 mL	0.4304 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。