

AEB071 ; Sotrastaurin

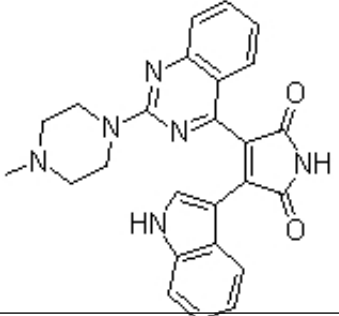
产品编号 : MB4599

质量标准 : >98% , pan-PKC 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C25H22N6O2	结 构 式	
分子量	438.48		
CAS No.	425637-18-9		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 87 mg/mL (198.41 mM)		
	Water : Insoluble		
	Ethanol : 2 mg/mL (4.56 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 : Sotrastaurin 是一种有效的 pan-PKC 抑制剂, 作用于 PKC θ , PKC β , PKC α , PKC η , PKC δ 和 PKC ϵ 。

别名 : AEB071 ; 1H-Pyrrole-2,5-dione,
3-(1H-indol-3-yl)-4-[2-(4-methyl-1-piperazinyl)-4-quinazolinyl]-

物理性状及指标 :

外观 :粉色至红色固体

溶解性 :DMSO : 87 mg/mL (198.41 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : 2 mg/mL (4.56 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	Sotrastaurin 是一种有效的, 选择性的泛 PKC 抑制剂, 最有效作用于 PKC θ , 无细胞试验中 K _i 为 0.22 nM ; 对 PKC ζ 没有活性。Phase 2。				
特性	同以往的 PKC 抑制剂不同 ,AEB071 并不会在激活诱导的细胞死亡模型中增强鼠 T 细胞原幼细胞的凋亡。				
靶点	PKC θ (Cell-free assay)	PKC β 1 (Cell-free assay)	PKC α (Cell-free assay)	PKC η (Cell-free assay)	PKC δ (Cell-free assay)
	0.22 nM(Ki)	0.64 nM(Ki)	0.95 nM(Ki)	1.8 nM(Ki)	2.1 nM(Ki)
体外研究	在人和鼠的早期 T 细胞中, 毫微摩尔级浓度的 AEB071 (< 10 μ M) 则能有效消除早期 T 细胞激活的信号如白介素-2 分泌物和 CD25 表达。在没发生非特异性抗增殖的效应的细胞中, AEB071 (200 nM) 能抑制 CD3/CD28 抗体和同种抗原诱导的 T 细胞增殖反应。AEB071 (<3 μ M) 可以显著抑制淋巴细胞功能相关抗原 1 介导的 T 细胞的粘附作用。AEB071 (< 20 μ M) 特异性地降低 CD79 突变体 ABC DLBCL 细胞系的增殖, 随之能减少 NF- κ B 信号活性。3 μ M 浓度的 AEB071 可诱导 CD79 突变细胞在 G1 阻断和/或细胞坏死。				
体内研究	AEB071(80 mg/kg) 可以在体内显著抑制 SCID 的皮下 TMD8 移植模型肿瘤的生长。每日两次口服 10 mg/kg 和 30 mg/kg AEB071, 能延长心脏移植的大鼠的存活率, 这种作用是剂量依赖抑制免疫力的效应。				

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
--------	-------------------------

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。Sotrastaurin 是一种有效的 pan-PKC 抑制剂, 最有效作用于 PKC θ , 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓	质量 积	1 mg	5 mg	10 mg
		2.2806 mL	11.4030 mL	22.8061 mL
1 mM				
5 mM		0.4561 mL	2.2806 mL	4.5612 mL

10 mM	0.2281 mL	1.1403 mL	2.2806 mL
50 mM	0.0456 mL	0.2281 mL	0.4561 mL

经典实验操作（仅供参考）

动物实验	<p>Animal Models: 雄性 Wistar/F 大鼠</p> <p>Formulation: 生理盐水</p> <p>Dosages: 10 mg/kg 和 30 mg/kg</p> <p>Administration: 口服一次</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 ²)	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。