

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	S10052
产品名称:	Salirasib

产品简介:

一种具有潜在抗肿瘤活性的水杨酸衍生物, 是有效的 PPMTase 抑制剂, K_i : $2.6 \mu\text{M}$; 也可抑制 Ras 甲基化。

靶点: K_i : $2.6 \mu\text{M}$ (PPMTase)

体外研究:

Salirasib (12.5 – $100 \mu\text{M}$) inhibits the proliferation of ELT3 cells in a dose-dependent manner with an average IC_{50} of $58.57 \pm 4.59 \mu\text{M}$. The effects of Salirasib on the TSC2-null cells are evidently mimicked by DN-Rheb but not by DN-Ras. Salirasib reduces Rheb in TSC2-null cells and TSC2 expression rescues the cells from the inhibitory effect of Salirasib. Salirasib reduces phosphorylation of S6K but not of ERK in the TSC2-null ELT3 cells. Salirasib (50 , 100 , $150 \mu\text{M}$) induces a dose- and time-dependent decrease of cell growth in HCC cells. Salirasib reduces cell proliferation through modulation of cell cycle effectors and inhibitors. Salirasib induces apoptosis in HepG2 and Hep3B cells. The growth inhibitory effect of salirasib in HCC cell lines is associated with mTOR inhibition independent of ERK or Akt activation.

体内研究:

Salirasib (40 , 60 or 80 mg/kg , p.o.) significantly inhibits the tumor growth in a dose dependent manner in vivo. Salirasib (5 mg/kg , i.p.) significantly decreases Ras expression in the dy 2J/dy 2Jmice, and causes an increase in Ras expression which is by far much lower than the increase observed in the dy 2J/dy 2J mice. Salirasib treatment is associated with significantly inhibition of both MMP-2 and MMP-9 activities in the dy 2J/dy 2J mice. Salirasib (10 mg/kg , i.p.) inhibits tumour growth in a subcutaneous xenograft mice model without weight loss.

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
DMSO: 溶于 DMSO (20 mg/mL)				
浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
	1 mM			
	5 mM			
10 mM		0.2789 mL	1.3945 mL	2.7891 mL
储备液的保存方式: -80°C , 2 years; -20°C , 1 year.				
二: 体内实验				



1、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.97 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。

2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (6.97 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 2.5 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE- β -CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.97 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。

以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

注: 工作液建议您现用现配, 当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得, 实际溶液度可能与公布值有所偏差, 属于正常的批间细微差异现象。

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

三、激酶实验

PPMTase 试验:

大鼠小脑突触体膜或培养细胞系的总膜(100,000 $\times$ g 沉淀)用于无细胞体系中甲基转移酶测定。甲基转移酶 在 总 体 积 为 50 μ L 的 50 mM Tris-HCl 缓冲液中, pH 7.4, 使用 100 μ g 蛋白质, 25 μ M [methyl 3H]AdoMet (300,000 cpm/nmol), 和 50 μ M AFC (在 DMSO 中以原液制备), 于 37 $^{\circ}$ C 下进行测定。所有试验的 DMSO 浓度为 8%。不同 AFC 浓度按照指示用于各实验中。加入 500 μ L 氯仿: 甲醇(1:1) 10 分钟后, 终止反应, 随后加入 250 μ L H₂O, 混合, 并相分离。氯仿相的 125- μ L 部分在 40 $^{\circ}$ C 下干燥, 并加入 200 μ L 的 1 N NaOH 和 1% SDS 溶液。因此形成的甲醇通过气相平衡法计算。典型的背景计数(无 AFC 添加)为 50-100 cpm, 而与 AFC 的典型反应产生 500-6,000 cpm。试验以一式三份进行, 减去背景计数。使内源性底物甲基化, 并进行凝胶电泳。完整细胞中的蛋白质羧基甲基化使用 10 0 μ Ci/mL [methyl3H]甲硫氨酸测定。细胞近似铺满培养基, 在含有 5 mL 标记培养基的 10-cm 板中生长测定。

四、细胞实验

细胞系: PC12, CHE, T 抗原转化的 CHE, 内皮细胞, 星形胶质细胞, B16, Rat1, EJ, NIH3T3, v-Raf 转化的 NIH3T3 细胞系

浓度: ~ 100 μ M

处理时间: 10 天

方法: 细胞在 24 孔板中生长。接种 2 小时后, 将细胞中加入溶剂或从原液中新鲜制备的 FTS, 以得到在 0.1% DMSO 中的最终指示浓度。培养基每 4 天用包含溶剂或药物的新鲜培养基取代。分离实验表明溶剂本身对细胞生长没有作用。在指示期间, 细胞通过台盼蓝/EDTA 从板上分离, 并在光学显微镜下计数。所有试验以一式四份进行。在平行实验中, 细胞用台盼蓝或 MTT 着色, 着色的细胞在光学显微镜下检查。在一些 MTT

染色的培养基中, 细胞溶解在 0.2 mL 100% DMSO 中, 染色程度使用酶联免疫吸附测定阅读器分光光度法测定。

五、动物实验

动物模型: Panc-1 异种移植的裸鼠

剂量: 每天 5 mg/kg

给药处理: i. p.





Beijing Psaitong
Biotechnology Co., Ltd

注意事项:

- | |
|-----------------------------|
| 1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。 |
| 2、以上信息仅做参考交流之用。 |

储存: -20℃

*更多产品请登陆官网查询。
*本公司产品仅用于科研。

真实 准确 稳定 负责

010-60605840
www.jm-bio.com
psaitong@jm-bio.com

