

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	K70029
产品名称:	KIRA6

产品简介:

一种小分子 IRE1 α RNase 激酶抑制剂, IC50 值为 0.6 μ M。KIRA6 可以触发细胞凋亡(apoptotic) 反应。	
靶点:	IC50: 0.6 μ M (IRE1 α RNase kinase)
体外研究:	
KIRA6 (1nM-100 μ M) 结合到 KIT 的胞质结构域, Kd 值为 10.8 μ M。 KIRA6 (10-1000 nM; 72 小时) 以与 KIT 阻断一致的方式在低 nM 浓度下强烈损害 KIT 依赖性细胞系 HMC-1.1 的活力。 KIRA6 (10-1000 nM; 1 小时) 减少 KIT 的信号输出, 包括 KIT 及其下游信号模块、PSTAT5 和磷酸化的 ERK1/2。 KIRA6 (1 μ M; 0-48 小时) 以剂量依赖性方式抑制 IRE1 α 过度激活引起的 Ins1 mRNA 衰变。KIRA6 (0.1-10 μ M; 72 小时) 剂量依赖性地降低 1NM-PP1 内质网应激过程中 Ins1 细胞凋亡呈剂量依赖性增强。	
体内研究:	
KIRA6 (腹膜内注射; 5 mg/kg; 37 天) 处理后, 葡萄糖水平在数周内显著改善。 KIRA6 (腹膜内注射; 5 mg/kg; 注射后 21 或 18 天) 增加血浆胰岛素和 C 肽水平, 在秋田小鼠停止注射后胰岛素阳性胰岛区域仍保持高水平。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 25 mg/mL (48.21 mM; 超声助溶)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	1.9285 mL	9.6426 mL	19.2853 mL
5 mM	0.3857 mL	1.9285 mL	3.8571 mL
10 mM	0.1929 mL	0.9643 mL	1.9285 mL
储备液的保存方式: -80° C, 1 year; -20° C, 6 months.			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 45% Saline Solubility: $\geq$ 0.5 mg/mL (0.96 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 0.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 5.0 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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE- β -CD in Saline) Solubility: $\geq$ 0.5 mg/mL (0.96 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 0.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。			



以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 5.0 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。

2 g SBE- β -CD (磺丁基醚 β -环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中，完全溶解至澄清透明。

3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil

Solubility: ≥ 0.5 mg/mL (0.96 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥ 0.5 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 5.0 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。

四、动物实验

动物模型：BALB/c 小鼠

剂量：10 mg/kg

给药处理：i.p.

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° C

