

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	U10073
产品名称:	8-甲酰基-7-羟基-4-甲基香豆素

产品简介:

是 IRE1α 的小分子抑制剂。 4μ8C, also known as IRE1 Inhibitor III, is a IRE1 Inhibitor. 4μ8C inhibits IRE1α splicing of Xbp1 mRNA (IC₅₀ = 6.8 μM) and reduces subsequent gene expression of Erdj4 (IC₅₀ = 3.4 μM) in stress-cultured MEF cells but does not block IRE1α autophosphorylation.	
靶点:	IRE1 Rnase (Cell-free assay) 76 nM
体外研究: 当应用于 ER 应激培养细胞的培养基时, 4u8C (IRE1 Inhibitor III) 以浓度依赖性方式抑制 Xbp1 剪接。4u8C 与 IRE1 缓慢解离, 但没有抑制剂导致细胞中 Xbp1 剪接快速恢复。IRE1 核糖核酸内切酶抑制剂 4u8c 阻止 XBP1 mRNA 剪接响应由突变体引起的 ER 应激胰岛素原产生。需要肌醇的酶 1α (IRE1α) 是一种丝氨酸-苏氨酸激酶, 在激活未折叠蛋白反应中起着至关重要的作用。4u8C 处理可显著抑制 Th0 条件下 CD4⁺ T 细胞产生 IL-4, 因为 4u8C 处理可降低培养物上清液中的 IL-4 水平和 IL-4 阳性细胞的百分比。此外, 用 4u8C 处理后, IL-5 和 IL-13 的产生均显著降低。	
体内研究: 4u8c (IRE1 Inhibitor III) (腹腔注射; 10 mg/kg/天, 再持续 4 周) 导致 en face 主动脉制剂中的动脉粥样硬化病变区域显著减少 (45.2%)。4u8c 可有效减轻小鼠体内斑块的形成。 4u8C (口服; 10、50 或 100 mg/kg) 可抑制小鼠的被动皮肤过敏反应 (PCA) (ED₅₀=25.1 mg/kg)。 4u8C 逆转几个已知 RIDD 靶标的 ER 应激依赖性损失, EC₅₀ 约为 4 μM, 接近抑制 XBP1 靶基因激活。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验				
DMSO: 溶于 DMSO (≥ 27 mg/mL)				
浓度	质量	1mg	5mg	10mg
	溶液体积			
	1 mM			
	5 mM			
10 mM		0.4898 mL	2.4488 mL	4.8976 mL
储备液的保存方式: -80 $^{\circ}$ C, 1 year; -20 $^{\circ}$ C, 6 months.				
二: 体内实验				
1、请依序添加每种溶剂: 15% Cremophor EL $\rightarrow$ 85% Saline				
Solubility: 25 mg/mL (122.44 mM); 悬浊液; 超声助溶				
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

体外 IRE1 RNase 和 RIDD 试验：

放射性标记的 Xbp1 底物裂解分析如先前方法进行，除了哺乳动物 IRE1 反应缓冲液的使用。使用 T7-MAXIscript 试剂盒，在 32P ATP 或 Cy5-UTP 存在下，通过从小鼠 Min6 细胞(Ins2)的 RT-PCR 或无性繁殖 XBP1 cDNA 的 PCR 分离得到的模板，体外转录合成 RIDD。得到的产品通过凝胶纯化以得到全长底物。然后反应被 15% UREA-PAGE 分离用于分析，通过感光成像或近红外呈像，使用 LI-COR Odyssey 扫描仪。

四、细胞实验

细胞系：野生型 MEFs

浓度：~128 μ M

处理时间：24 小时

方法：将细胞分别以 5×10^3 或 5×10^4 个细胞每孔的密度接种于 96 或 24 孔板，在无酚红细胞培养基中进行培养。将培养基培育 16 小时，再用 4 μ 8C 处理 24 小时。然后培养基中加入 200 μ M WST1 和 10 μ M 吩嗪 N-甲硫酸盐进行分析。反应物在 37° C 下反应 2 小时后，水解染料在 450 nm 的吸光度减去背景在 595 nm 的吸光度进行检测。或者，细胞活性通过用结晶紫染色培养基的贴壁细胞进行确定。上染率的定量通过着色细胞用过量水和结晶紫的甲醇溶液洗涤，然后在 595 nm 下测定吸光度进行分析。

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℃

