



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyysw@sina.com

产品名称: **Oncrasin 1**
CAS 号: **75629-57-1**
产品货号: **S86422**

生物活性:

Description	Oncrasin-1 是一种 RNA 聚合酶 抑制剂。Oncrasin-1 可抑制 RNA 聚合酶 II 最大亚基的磷酸化以及敏感细胞中无内含子报告基因的表达。Oncrasin-1 可有效杀死多种携带 K-Ras 突变的人类肺癌细胞。Oncrasin-1 可导致 PKC ι 和剪接因子共聚集成巨剪接体。Oncrasin-1 可诱导 RNA 加工机制发生功能障碍。Oncrasin-1 是一种抗癌药物，因此可用于肺癌研究。											
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description								
	A549	IC ₅₀	$\leq 3 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human A549 cells by SRB assay								
	A549	IC ₅₀	$2.48 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human A549 cells after 72 hrs by MTT assay								
	HT-29	IC ₅₀	$1.71 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human HT-29 cells after 72 hrs by MTT assay								
	MDA-MB-231	IC ₅₀	$26.1 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human MDA-MB-231 cells after 72 hrs by MTT assay								
	NCI-H2122	IC ₅₀	$\leq 3 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human NCI-H2122 cells by SRB assay								
	NCI-H460	IC ₅₀	$\leq 3 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human H460 cells by SRB assay								
	NCI-H460	IC ₅₀	$0.25 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human H460 cells assessed as cell viability after 3 days by sulforhodamine B assay								
	NCI-H460	IC ₅₀	$0.85 \mu\text{M}$	Cytotoxicity against human H460 cells after 72 hrs by MTT assay								
In Vitro	Oncrasin-1 ($0.1\text{-}33 \mu\text{M}$, 3 天) 在 T29Kt1 细胞中诱导剂量依赖性细胞毒性 ($\text{IC}_{50} = 4.81 \mu\text{M}$)[1]。 Oncrasin-1 ($31\text{ nM}\text{-}33 \mu\text{M}$) 可有效杀死 K-Ras 突变体 H460、H2122、H2887 和 A549 细胞，$\text{IC}_{50} \leq 3 \mu\text{M}$[1]。 Oncrasin-1 ($1\text{-}10 \mu\text{M}$, 12 小时) 可增加细胞凋亡百分比，并导致 H460 和 T29K1 细胞中 PKC ι 的亚细胞定位发生显著变化细胞[1]。 Oncrasin-1 ($33\text{ nM}\text{-}3.3 \mu\text{M}$, 24 小时) 对癌症细胞 (H460) 的细胞毒性是由诱导细胞凋亡导致的[1]。 Oncrasin-1 ($1 \mu\text{M}$, 12 小时) 显示 K-Ras 是诱导细胞凋亡所必需的[1]。 Oncrasin-1 ($1 \mu\text{M}$, 4-12 小时) 显著抑制 H460 和 T27Kt1 细胞中荧光素酶的表达，但对 T29 细胞无影响或仅有轻微影响[2]。 Oncrasin-1 ($1 \mu\text{M}$, 12 小时) 在 H460 细胞系中破坏 PKC ι 与细胞周期蛋白 T1 之间的相互作用，导致转录功能障碍[2]。 Western Blot Analysis[1] <table><tr><td>Cell Line:</td><td>H460 cells</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>33 nM, 100 nM, 330 nM, $1 \mu\text{M}$, $3.3 \mu\text{M}$</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>24 h</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Activated caspase 3 and 8 effectively.</td></tr></table> Western Blot Analysis[2]				Cell Line:	H460 cells	Concentration:	33 nM, 100 nM, 330 nM, $1 \mu\text{M}$, $3.3 \mu\text{M}$	Incubation Time:	24 h	Result:	Activated caspase 3 and 8 effectively.
	Cell Line:	H460 cells										
	Concentration:	33 nM, 100 nM, 330 nM, $1 \mu\text{M}$, $3.3 \mu\text{M}$										
	Incubation Time:	24 h										
	Result:	Activated caspase 3 and 8 effectively.										



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	<table><tr><td>Cell Line:</td><td>H460, T29, T29Kt1</td></tr><tr><td>Concentration:</td><td>1 μM for H460, 10 μM for T29 and T29Kt1</td></tr><tr><td>Incubation Time:</td><td>12 h</td></tr><tr><td>Result:</td><td>Led to a dramatic suppression of phosphorylated RNA polymerase II and some SR proteins. Reduced the phosphorylation of RNA polymerase II and SR proteins starting at 8 h.</td></tr></table>	Cell Line:	H460, T29, T29Kt1	Concentration:	1 μM for H460, 10 μM for T29 and T29Kt1	Incubation Time:	12 h	Result:	Led to a dramatic suppression of phosphorylated RNA polymerase II and some SR proteins. Reduced the phosphorylation of RNA polymerase II and SR proteins starting at 8 h.									
Cell Line:	H460, T29, T29Kt1																	
Concentration:	1 μM for H460, 10 μM for T29 and T29Kt1																	
Incubation Time:	12 h																	
Result:	Led to a dramatic suppression of phosphorylated RNA polymerase II and some SR proteins. Reduced the phosphorylation of RNA polymerase II and SR proteins starting at 8 h.																	
In Vivo	Oncrasin-1 (100 mg/kg, 腹腔注射, 每日一次, 连续 10 天) 可抑制背部接种 H460 细胞的裸鼠 75.4% 的肿瘤生长, 并延长裸鼠的存活时间[1].																	
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (370.74 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)																	
	<table><tr><td rowspan="4">Preparing Stock Solutions</td><td> Solvent Mass Concentration </td><td>1 mg</td><td>5 mg</td><td>10 mg</td></tr><tr><td>1 mM</td><td>3.7074 mL</td><td>18.5371 mL</td><td>37.0741 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.7415 mL</td><td>3.7074 mL</td><td>7.4148 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.3707 mL</td><td>1.8537 mL</td><td>3.7074 mL</td></tr></table>	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	3.7074 mL	18.5371 mL	37.0741 mL	5 mM	0.7415 mL	3.7074 mL	7.4148 mL	10 mM	0.3707 mL	1.8537 mL	3.7074 mL
	Preparing Stock Solutions		Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg												
			1 mM	3.7074 mL	18.5371 mL	37.0741 mL												
			5 mM	0.7415 mL	3.7074 mL	7.4148 mL												
10 mM		0.3707 mL	1.8537 mL	3.7074 mL														
*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。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: 2.5 mg/mL (9.27 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (9.27 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水处理液 中, 混合均匀。																		



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	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。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: 2.5 mg/mL (9.27 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 mg/mL 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Guo W, et al. Identification of a small molecule with synthetic lethality for K-ras and protein kinase C iota. Cancer Res. 2008 Sep 15;68(18):7403-8. [2]. Guo W, et al. Interruption of RNA processing machinery by a small compound, 1-[(4-chlorophenyl)methyl]-1H-indole-3-carboxaldehyde (oncrasin-1). Mol Cancer Ther. 2009 Feb;8(2):441-8.

完整储备液配制表:

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。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.7074 mL	18.5371 mL	37.0741 mL	92.6853 mL
	5 mM	0.7415 mL	3.7074 mL	7.4148 mL	18.5371 mL
	10 mM	0.3707 mL	1.8537 mL	3.7074 mL	9.2685 mL
	15 mM	0.2472 mL	1.2358 mL	2.4716 mL	6.1790 mL
	20 mM	0.1854 mL	0.9269 mL	1.8537 mL	4.6343 mL
	25 mM	0.1483 mL	0.7415 mL	1.4830 mL	3.7074 mL
	30 mM	0.1236 mL	0.6179 mL	1.2358 mL	3.0895 mL
	40 mM	0.0927 mL	0.4634 mL	0.9269 mL	2.3171 mL
	50 mM	0.0741 mL	0.3707 mL	0.7415 mL	1.8537 mL
	60 mM	0.0618 mL	0.3090 mL	0.6179 mL	1.5448 mL
	80 mM	0.0463 mL	0.2317 mL	0.4634 mL	1.1586 mL
	100 mM	0.0371 mL	0.1854 mL	0.3707 mL	0.9269 mL