



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

产品名称: **R-IMPP**
CAS 号: **2133832-83-2**
产品货号: **S88580**

生物活性:

Description	R-IMPP (PF-00932239) 是一种 PCSK9 的抗分泌活性分子 (IC ₅₀ =4.8 μM), 其靶向 80S 核糖体抑制 PCSK9 蛋白翻译。			
IC ₅₀ & Target	IC ₅₀ : 4.8 μM (PCSK9)[1]			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Bone marrow cell	IC ₅₀	> 20 μM	Cytotoxicity against rat bone marrow cells assessed as reduction in cell viability after 72 hrs by CellTiter-Glo assay
	CHO-K1	IC ₅₀	4.8 μM	Inhibition of human recombinant full length ProLabel-tagged PCSK9 expressed in CHO-K1 cells incubated overnight and measured after 3 days by HTS assay
	CHO-K1	IC ₅₀	4.8 μM	Inhibition of 80s ribosome in CHOK1 cells assessed as reduction in PL-tagged PCSK9 expression incubated for over night by EFC kit method
	CHO-K1	IC ₅₀	< 10 μM	Inhibition of human recombinant full length ProLabel-tagged PCSK9 expressed in CHO-K1 cells incubated overnight and measured after 3 days by chemiluminescence assay
	CHO-K1	IC ₅₀	> 10 μM	Cytotoxicity against CHOK1 cells expressing human recombinant full length ProLabel-tagged PCSK9 after overnight incubation by CellTiter blue assay
	CHO-K1	IC ₅₀	> 10 μM	Inhibition of human recombinant PCSK9 expressed in CHO-K1 cells assessed as alkaline phosphatase secretion incubated overnight and measured after 3 days by HTS assay
	HeLa	IC ₅₀	8.04 μM	Binding affinity to 80S ribosome in human HeLa cells lysates using human full length PCSK9 encoding mRNAs assessed as inhibition of PCSK9 mRNA translation after 45 mins by Steady-Glo luciferase reporter gene assay
	Huh-7	IC ₅₀	2.2 μM	Inhibition of PCSK9 expression in human HuH7 cells after overnight incubation by ELISA
	Huh-7	IC ₅₀	2.63 μM	Binding affinity to 80S ribosome in human HuH7 cells harboring pCMV-truncated human PCSK9 (1 to 152 residues)-proLuc assessed as inhibition of PCSK9 mRNA translation after overnight incubation by luciferase reporter gene assay
	Huh-7	IC ₅₀	2.63 μM	Binding affinity to 80S ribosome in human HuH7 cells harboring human PCSK9 (1 to 152 residues)-proLuc



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

				assessed as inhibition of PCSK9 mRNA translation after overnight incubation by luciferase reporter gene assay	
	Huh-7	IC ₅₀	8.37 μM	Binding affinity to 80S ribosome in human HuH7 cells assessed as inhibition of PCSK9 mRNA translation after overnight incubation by ELISA	
In Vitro	R-IMPP 通过增加 LDL-R 水平刺激肝癌细胞摄取 LDL-C, 而不改变分泌的转铁蛋白水平。 R-IMPP 不会降低 PCSK9 转录或增加 PCSK9 降解, 但会导致转录依赖性 PCSK9 翻译抑制。 R-IMPP 能够选择性地与人类核糖体结合, 但不能与大肠杆菌核糖体结合[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (256.75 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)				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.5675 mL	12.8373 mL	25.6746 mL
		5 mM	0.5135 mL	2.5675 mL	5.1349 mL
		10 mM	0.2567 mL	1.2837 mL	2.5675 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 (6.42 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 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 (6.42 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 生理盐盐水溶液 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.42 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 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]. Petersen DN, et al. A Small-Molecule Anti-secretagogue of PCSK9 Targets the 80S Ribosome to Inhibit PCSK9 Protein Translation. Cell Chem Biol. 2016 Nov 17;23(11):1362-1371.

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	2.5675 mL	12.8373 mL	25.6746 mL	64.1865 mL
	5 mM	0.5135 mL	2.5675 mL	5.1349 mL	12.8373 mL
	10 mM	0.2567 mL	1.2837 mL	2.5675 mL	6.4187 mL
	15 mM	0.1712 mL	0.8558 mL	1.7116 mL	4.2791 mL
	20 mM	0.1284 mL	0.6419 mL	1.2837 mL	3.2093 mL
	25 mM	0.1027 mL	0.5135 mL	1.0270 mL	2.5675 mL
	30 mM	0.0856 mL	0.4279 mL	0.8558 mL	2.1396 mL
	40 mM	0.0642 mL	0.3209 mL	0.6419 mL	1.6047 mL
	50 mM	0.0513 mL	0.2567 mL	0.5135 mL	1.2837 mL
	60 mM	0.0428 mL	0.2140 mL	0.4279 mL	1.0698 mL
	80 mM	0.0321 mL	0.1605 mL	0.3209 mL	0.8023 mL
	100 mM	0.0257 mL	0.1284 mL	0.2567 mL	0.6419 mL