



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: **PKR-IN-C16**

CAS 号: **608512-97-6**

产品货号: **S89082**

生物活性:

Description	PKR-IN-C16 (Compound C16) 是一种特异的双链 RNA 依赖蛋白激酶 (PKR) 抑制剂。PKR-IN-C16 具有良好的神经保护作用, 可挽救急性脑损伤。				
IC50 & Target	PKR[1]				
In Vitro	PKR-IN-C16 能够解锁原代神经元培养中 PKR 诱导的翻译阻断[1]。				
	PKR-IN-C16 (0.1 或 0.3 μM; 24 小时) 对 SH-SY5Y 细胞中内质网应激诱导的神经元细胞死亡具有保护作用[1]。				
	PKR-IN-C16 (1-1000 nM; 4 小时) 不仅可以阻止 PKR 磷酸化, 还可以阻止 SH-SY5Y 细胞中淀粉样蛋白 β 诱导的 caspase-3 活化[2]。				
	Western Blot Analysis[2]				
	Cell Line:	Human SH-SY5Y cells			
	Concentration:	1, 10, 20, 200, 1000 nM			
In Vivo	Incubation Time:	4 h			
	Result:	Markedly reduces the level of phosphorylated PKR in the cells exposed to 20 μM Amyloid β.			
	PKR-IN-C16 (60 或 600 μg/kg; 腹腔注射; 3 次) 不仅可以预防 PKR 诱导的神经元丢失, 还可以预防 Quinolinic acid (QA)诱导的急性兴奋毒性大鼠模型中的炎症反应[1]				
	Animal Model:	Normotensive male Wistar rats, excitotoxic neuroinflammatory model, inflammation was induced by unilateral striatal injection of quinolinic acid (QA)[1]			
	Dosage:	60 or 600 μg/kg			
	Administration:	Intraperitoneal injection; 24 h, 2 h before QA injection and 24 h post-QA injection			
Solvent&Solubility	Result:	Reduced expression of the active catalytic domain of the PKR, prevented increase of IL-1β levels on the contralateral side (97% inhibition) at 600 μg/kg. Decreased by 47% the neuronal loss and by 37% the number of positive cleaved caspase-3 neurons induced by QA injection at 600 μg/kg.			
	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 10 mg/mL (37.27 mM; 超声助溶 (<60°C); 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	3.7273 mL	18.6365 mL	37.2731 mL
		5 mM	0.7455 mL	3.7273 mL	7.4546 mL
10 mM		0.3727 mL	1.8637 mL	3.7273 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, 1 year; -20°C, 6 months。-80°C 储存时, 请在 1 年内使用, -20°C 储存时, 请在 6 个月内使用。					



	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: ≥ 1 mg/mL (3.73 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 10.0 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 ddH₂O 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% Corn Oil Solubility: ≥ 1 mg/mL (3.73 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1 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 10.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。 以下溶解方案，请直接配制工作液。建议现用现配，在短期内尽快用完。 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： 0.5% CMC-Na/saline water Solubility: 20 mg/mL (74.55 mM); 悬浊液；超声助溶 方案 二 请依序添加每种溶剂： 15% Cremophor EL → 85% Saline Solubility: 10 mg/mL (37.27 mM); 悬浊液；超声助溶。
参考文献	[1]. Tronel C, et al. The specific PKR inhibitor C16 prevents apoptosis and IL-1β production in an acute excitotoxic rat model with a neuroinflammatory component. Neurochem Int. 2014 Jan;64:73-83. [2]. Page G, et al. Activated double-stranded RNA-dependent protein kinase and neuronal death in models of Alzheimer's disease. Neuroscience. 2006;139(4):1343-54.

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, 1 year; -20° C, 6 months。-80° C 储存时，请在 1 年内使用， -20° C 储存时，请在 6 个月内使用。

可选溶剂	质量	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
	溶剂体积				
	浓度				



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

DMSO	1 mM	3.7273 mL	18.6365 mL	37.2731 mL	93.1827 mL
	5 mM	0.7455 mL	3.7273 mL	7.4546 mL	18.6365 mL
	10 mM	0.3727 mL	1.8637 mL	3.7273 mL	9.3183 mL
	15 mM	0.2485 mL	1.2424 mL	2.4849 mL	6.2122 mL
	20 mM	0.1864 mL	0.9318 mL	1.8637 mL	4.6591 mL
	25 mM	0.1491 mL	0.7455 mL	1.4909 mL	3.7273 mL
	30 mM	0.1242 mL	0.6212 mL	1.2424 mL	3.1061 mL



源叶