



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: **Bisindolylmaleimide VIII acetate**

CAS 号: **138516-31-1**

产品货号: **T40685**

生物活性:						
Description	Bisindolylmaleimide VIII acetate (Ro 31-7549 acetate) is a potent and selective protein kinase C (PKC) inhibitor with an IC50 of 158 nM for rat brain PKC. Bisindolylmaleimide VIII acetate has IC50s of 53, 195, 163, 213, and 175 nM for PKC-α, PKC-βI, PKC-βII, PKC-γ, PKC-ε, respectively[1]. Bisindolylmaleimide VIII acetate facilitates Fas-mediated apoptosis and inhibits T cell-mediated autoimmune diseases[2].					
IC50 & Target	Rat Brain PKC 158 nM (IC50)	PKC-α 53 nM (IC50)	PKC-βI 195 nM (IC50)	PKC-βII 163 nM (IC50)	PKC-γ 213 nM (IC50)	PKC-ε 175 nM (IC50)
In Vitro	Bisindolylmaleimide VIII acetate (Ro 31-7549 acetate; 5 μM; 8, 12 hours) dramatically increases TRA-8-induced cell death in time-dependent and TRA-8 dose-dependent manners[2].					
	Bisindolylmaleimide VIII acetate (5 μM; 6 hours) significantly decreases procaspase-8 at 4 h and completely disappears at 6 h after the combined treatment with TRA-8[2].					
	Apoptosis Analysis[2]					
	Cell Line:	1321N1 cells				
	Concentration:	5 μM				
	Incubation Time:	8, 12 hours				
	Result:	Dramatically increased TRA-8-induced cell death in time-dependent and TRA-8 dose-dependent manners.				
	Western Blot Analysis[2]					
	Cell Line:	1321N1 cells				
	Concentration:	5 μM				
Incubation Time:	6 hours					
Result:	Significantly decreased procaspase-8 at 4 h and completely disappeared at 6 h.					
In Vivo	Bisindolylmaleimide VIII acetate (Ro 31-7549 acetate; 100 μg; IP; every other day for three doses) results in nearly complete tumor regression combined to TRA-8. The treatment with Bisindolylmaleimide VIII acetate alone does not induce significant tumor regression[2].					
	Animal Model: 6-8-week-old female NOD/SCID mice[2].					
	Dosage: 100 μg					
	Administration: IP; every other day for three doses					
Solvent&Solubility	Result: Resulted in nearly complete tumor regression combined to TRA-8.					
	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (545.24 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	2.1810 mL	10.9049 mL	21.8098 mL	
5 mM		0.4362 mL	2.1810 mL	4.3620 mL		
	10 mM	0.2181 mL	1.0905 mL	2.1810 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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 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: ≥ 2.08 mg/mL (4.54 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.54 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 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。
参考文献	[1]. Wilkinson SE, et al. Isoenzyme specificity of bisindolylmaleimides, selective inhibitors of protein kinase C. Biochem J. 1993 Sep 1;294 (Pt 2):335-7. [2]. Ohtsuka T, et al. Bisindolylmaleimide VIII enhances DR5-mediated apoptosis through the MKK4/JNK/p38 kinase and the mitochondrial pathways. J Biol Chem. 2002 Aug 9;277(32):29294-303.

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, 6 months; -20°C, 1 month (sealed storage, away from moisture)。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.1810 mL	10.9049 mL	21.8098 mL	54.5244 mL
	5 mM	0.4362 mL	2.1810 mL	4.3620 mL	10.9049 mL
	10 mM	0.2181 mL	1.0905 mL	2.1810 mL	5.4524 mL



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

	15 mM	0.1454 mL	0.7270 mL	1.4540 mL	3.6350 mL
	20 mM	0.1090 mL	0.5452 mL	1.0905 mL	2.7262 mL
	25 mM	0.0872 mL	0.4362 mL	0.8724 mL	2.1810 mL
	30 mM	0.0727 mL	0.3635 mL	0.7270 mL	1.8175 mL
	40 mM	0.0545 mL	0.2726 mL	0.5452 mL	1.3631 mL
	50 mM	0.0436 mL	0.2181 mL	0.4362 mL	1.0905 mL
	60 mM	0.0363 mL	0.1817 mL	0.3635 mL	0.9087 mL
	80 mM	0.0273 mL	0.1363 mL	0.2726 mL	0.6816 mL
	100 mM	0.0218 mL	0.1090 mL	0.2181 mL	0.5452 mL



源叶