

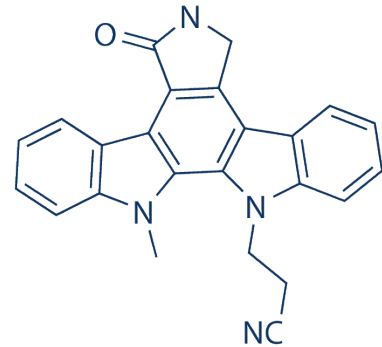
## Gö6976 (PKC抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC0357-10mM	Gö6976 (PKC 抑制剂)	10mM×0.2ml
SC0357-5mg	Gö6976 (PKC 抑制剂)	5mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	5,6,7,13-tetrahydro-13-methyl-5-oxo-12H-indolo[2,3-a]pyrrolo[3,4-c]carbazole-12-propanenitrile
简称	Gö6976
别名	Go 6976; Go-6976; Goe 6976
中文名	—
化学式	C <sub>24</sub> H <sub>18</sub> N <sub>4</sub> O
分子量	377.42
CAS号	136194-77-9
纯度	≥98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 18mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.32ml DMSO, 或者每3.77mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC0357-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Gö6976是一种强效的PKC抑制剂, 其对PKC(老鼠大脑), PKC $\alpha$ and PKC $\beta$ 1的IC50分别为7.9nM, 2.3nM和6.2nM。此外, 也是JAK2和Flt3的强抑制剂。				
信号通路	TGF-beta/Smad				
靶点	PKC $\alpha$	PKC $\beta$ 1	PKC (Rat brain)	JAK2	FLT3
IC50	2.3nM	6.2nM	7.9nM	—	—
体外研究	Gö6976对Ca(2+)不依赖性PKC亚型 $\delta$ , $\epsilon$ 和 $\zeta$ 的激酶活性没有作用。除了WT JAK2, Go6976也会抑制突变型血液恶性肿瘤(JAK2 V617F和TEL-JAK2), 且具有抗突变型FLT3的活性。在Aml细胞中, Gö6976将FLT3-ITD样品中的存活率降低到对照组的55%, FLT3-WT样品中降低为69%。Gö6976有效抑制苔藓抑素1, 肿瘤坏死因子 $\alpha$ 和白细胞介素6诱导的HIV-1。				
体内研究	Gö6976(2.5mg/kg i.p.), 作为PKD抑制剂, 通过抑制MAPKs活化作用以减少TNF- $\alpha$ 产生, 而有效防止LPS/D-GalN诱导的急性肝损伤, 并显著提高LPS/D-GalN攻击的小鼠的存活率。				
临床实验	N/A				
特征	N/A				

#### ➤ 相关实验数据(此数据来自于公开文献, 碧云天并不保证其有效性):

酶活性检测实验	
方法	简而言之, 对于测量大鼠脑中的PKC $\alpha$ , PKC $\beta$ 1和PKC, 200 $\mu$ l试验混合物包含50mM HEPES(pH7.5), 5mM MgCl <sub>2</sub> , 1mM EDTA, 1.25mM EGTA, 1.32mM CaCl <sub>2</sub> , 1mM 二硫苏糖醇, 1 $\mu$ g磷脂酰丝氨酸, 0.2 $\mu$ g二油精, 40 $\mu$ g组蛋白Hi, 10 $\mu$ M [ $\gamma$ - <sup>32</sup> P]ATP(1 $\mu$ Ci/ml)和5-10单位(pmol of Pi/min) PKC。加入[ $\gamma$ - <sup>32</sup> P]ATP开始测定, 在30°C下培养5分钟, 加入2ml 8.5% H <sub>3</sub> PO <sub>4</sub> 停止测定, 通过0.45 $\mu$ m硝化纤维素过滤器过滤, 并使用闪烁计数器进行评估。

细胞实验	
细胞系	原代Aml细胞
浓度	1 $\mu$ M
处理时间	48小时

方法	细胞以 $2 \times 10^5$ 每点悬浮在200 $\mu$ l RPMI/10% FCS。研究下的抑制剂以近似浓度加入，细胞在37°C，5% CO <sub>2</sub> 下培养48小时。MTS活性通过CellTiter试剂盒根据制造商说明进行测量。结果表示为对照组(没有抑制剂的细胞组)的百分比。
----	---

动物实验	
动物模型	LPS/D-GalN-攻击的小鼠
配制	DMSO
剂量	2.5mg/kg
给药方式	i.p.

#### 参考文献：

1. Martiny-Baron G, et al. J Biol Chem. 1993, 268(13), 9194-9197.
2. Grandage VL, et al. Br J Haematol. 2006, 135(3), 303-316.
3. Qatsha KA, et al. Proc Natl Acad Sci U S A. 1993, 90(10), 4674-4678.
4. Duan GJ, et al. Inflamm Res. 2011, 60(4), 357-366.

#### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC0357-10mM	Gö6976 (PKC抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC0357-5mg	Gö6976 (PKC抑制剂)	5mg
—	说明书	1份

#### 保存条件：

-20°C保存，至少一年有效。5mg包装也可室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80°C保存，预计6个月内有效。

#### 注意事项：

- 本产品可能对人体有一定的毒害作用，请注意适当防护，以避免直接接触人体或吸入体内。
- 本产品仅限于专业人员的科学研究用，不得用于临床诊断或治疗，不得用于食品或药品，不得存放于普通住宅内。
- 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

#### 使用说明：

1. 收到产品后请立即按照说明书推荐的条件保存。使用前可以在2,000-10,000g离心数秒，以使液体或粉末充分沉降至管底后再开盖使用。
2. 对于10mM溶液，可直接稀释使用。对于固体，请根据本产品的溶解性及实验目的选择相应溶剂配制高浓度的储备液(母液)后使用。
3. 具体的最佳工作浓度请参考本说明书中的体外、体内研究结果或其它相关文献，或者根据实验目的，以及所培养的特定细胞和组织，通过实验进行摸索和优化。
4. 不同实验动物依据体表面积等效剂量转换表请参考如下网页：  
<https://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2019.06.04