

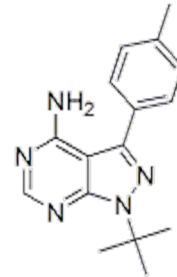
## PP1 (Src抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC1225-10mM	PP1 (Src抑制剂)	10mM×0.2ml
SC1225-5mg	PP1 (Src抑制剂)	5mg
SC1225-25mg	PP1 (Src抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	1-tert-butyl-3-(4-methylphenyl)pyrazolo[3,4-d]pyrimidin-4-amine
简称	PP1
别名	PP 1, PP-1
中文名	N/A
化学式	C <sub>16</sub> H <sub>19</sub> N <sub>5</sub>
分子量	281.36
CAS号	172889-26-8
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 4mg/ml; Ethanol <1mg/ml
溶液配制	5mg加入1.78ml DMSO, 或每2.81mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC1225-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	PP1是一种有效的Src选择性抑制剂, 作用于Lck/Fyn时, IC <sub>50</sub> 为5nM/6nM。				
信号通路	Angiogenesis				
靶点	LCK	Fyn	Kit	EGFR	Bcr-Abl
IC <sub>50</sub>	5nM	6nM	~75nM	250nM	1μM
体外研究	PP1是一种纳摩尔级的Lck和FynT抑制剂, 作用于T细胞, 抑制anti-CD3诱导的蛋白-酪氨酸激酶活性, IC <sub>50</sub> 为0.5μM, 作用于Lck和FynT选择性比ZAP-70高, 且与非T细胞依赖性的12-豆蔻酸-13-乙酸佛波醇/IL-2诱导的T细胞增殖相比, PP1优先抑制T细胞受体依赖性的anti-CD3诱导的T细胞增殖(IC <sub>50</sub> 为0.5μM)。PP1(1μM)选择性抑制IL-2基因的诱导, 但不抑制粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子或IL-2受体基因。PP1也抑制Src(IC <sub>50</sub> 为170nM)和Hck(IC <sub>50</sub> ,20nM)。PP1抑制A-431表皮生长因子受体自磷酸化(IC <sub>50</sub> 为0.25μM)效果低50-100倍。PP1也抑制Kit和Bcr-Abl 酪氨酸激酶, IC <sub>50</sub> 分别为75nM和1μM。PP1完全废除响应SCF的M07e细胞增殖, IC <sub>50</sub> 为0.5-1μM。PP1(1μM) 作用于完整细胞, 抑制SCF诱导的c-Kit自磷酸化, 且抑制MAPK和Akt的活化。PP1抑制肥大细胞疾病中发现的c-Kit组成性突变激活形式(D814V和D814Y)的活性, 作用于表达突变型c-Kit的大鼠嗜碱性的白血病细胞系RBL-2H3, 并触发细胞凋亡。PP1作用于表达Bcr-Abl的FDCP1细胞, 降低转录因子5和MAPK的信号转导和激活, 且促发凋亡。				
体内研究	N/A				
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	使用1X PBS按1:20稀释 酸处理过的烯醇化酶, 然后按100ml再分装到Nunc96孔高蛋白结合实验板中。然后吸除实验孔, 使用0.5%牛血清, 1X PBS在37°C下抑制1小时, 然后每孔使用300μl 1X PBS洗涤5次。Lck的来源是LSTRA细胞, 或使用牛痘表达系统表达Lck的HeLa细胞。FynT通过牛痘表达系统在HeLa细胞中表达。细胞(12.5×10 <sup>6</sup> ml)在裂解缓冲液(20mM Tris, pH 8.0, 150mM NaCl, 0.5% Nonidet P-40和23胰蛋白酶抑制单位/ml抑肽酶)中裂解, 裂解物在Eppendorf管中通过14000cpm转速下在4°C环境中离心14分钟而澄清。澄清的裂解物与合适的10μg/ml anti-激酶抗体在4°C下温育2小时。蛋白A琼脂糖珠添加到250μl/ml抗体/裂解物的混合物中, 在4°C下温育30分钟。琼脂糖珠在1ml裂解缓冲液洗涤两次, 然后在1ml激酶缓冲液(25mM HEPES, 3mM MnCl <sub>2</sub> , 5mM MgCl <sub>2</sub> 和100μM原钒酸钠)中再洗涤两次, 然后

	再悬浮在50%(w/v)激酶缓冲液中。25 $\mu$ l琼脂糖珠悬浮液添加到烯醇化酶包被的96孔高蛋白结合板的每孔中，与适当浓度的化合物和[ $\gamma$ -32P]ATP(每孔25 $\mu$ l 200 $\mu$ Ci/ml溶液，溶于激酶缓冲液)一起。孔中添加含10mM ATP的60 $\mu$ l沸腾的2 $\times$ 溶解缓冲液，终止反应。孔中移除30 $\mu$ l样品，煮沸5分钟，并在7.5% SDS-聚丙烯酰胺凝胶上跑胶。随后干燥凝胶，使用Kodak X-AR胶片处理。为了定量分析采用分子动力学激光扫描仪进行胶片扫描，测定主要的底物带的光密度，烯醇化酶p46。为了测量化合物抗Lck的活性，使用50mM EDTA，1mM ATP在Skatron收集器上洗涤实验板两轮。然后每孔加入100 $\mu$ l闪烁液，使用micro- $\beta$ -counter测量32P摄入率。
--	---

细胞实验	
细胞系	N/A
浓度	N/A
处理时间	N/A
方法	N/A

动物实验	
动物模型	N/A
配制	N/A
剂量	N/A
给药方式	N/A

➤ **参考文献:**

- 1.Hanke JH, et al. J Biol Chem. 1996, 271(2), 695-701.
- 2.Tatton L, et al. J Biol Chem. 2003, 278(7), 4847-4853.

**包装清单:**

产品编号	产品名称	包装
SC1225-10mM	PP1 (Src抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC1225-5mg	PP1 (Src抑制剂)	5mg
SC1225-25mg	PP1 (Src抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

**保存条件:**

-20 $^{\circ}$ C保存，至少一年有效。5mg和25mg包装也可以室温保存，至少6个月有效。如果溶于非DMSO溶剂，建议分装后-80 $^{\circ}$ C保存，预计6个月有效。

**注意事项:**

- 本产品对人体有害，操作时请小心，并注意有效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淀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、体内研究结果或其他相关文献，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：

<http://www.beyotime.com/support/animal-dose.htm>

Version 2017.11.01