

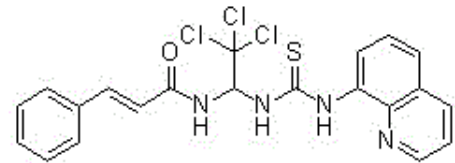
## Salubrinal (eIF2 $\alpha$ 去磷酸化抑制剂)

产品编号	产品名称	包装
SC4377-10mM	Salubrinal (eIF2 $\alpha$ 去磷酸化抑制剂)	10mM $\times$ 0.2ml
SC4377-5mg	Salubrinal (eIF2 $\alpha$ 去磷酸化抑制剂)	5mg
SC4377-25mg	Salubrinal (eIF2 $\alpha$ 去磷酸化抑制剂)	25mg

### 产品简介:

#### ➤ 化学信息:

化学名	(E)-3-phenyl-N-[2,2,2-trichloro-1-(quinolin-8-ylcarbamothioylamino)ethyl]prop-2-enamide
简称	Salubrinal
别名	F0095-1218, STL253110, CS-1012
中文名	N/A
化学式	C <sub>21</sub> H <sub>17</sub> Cl <sub>3</sub> N <sub>4</sub> OS
分子量	479.81
CAS号	405060-95-9
纯度	98%
溶剂/溶解度	Water <1mg/ml; DMSO 96mg/ml; Ethanol 2mg/ml
溶液配制	5mg加入1.04ml DMSO, 或每4.80mg加入1ml DMSO, 配制成10mM溶液。SC4377-10mM用DMSO配制。



#### ➤ 生物信息:

产品描述	Salubrinal是一种选择性eIF2 $\alpha$ 去磷酸化抑制剂, 可以抑制ER应激介导的细胞凋亡, 无细胞试验中EC50约为15 $\mu$ M。				
信号通路	Apoptosis				
靶点	eIF2 $\alpha$	—	—	—	—
IC50	—	—	—	—	—
体外研究	Salubrinal是一种选择性细胞复合体抑制剂, 是真核翻译起始因子2亚基 $\alpha$ (eIF2 $\alpha$ )去磷酸化的抑制剂。Salubrinal抑制蛋白糖基化抑制剂Tunicamycin(TM)诱导的ER应激介导的细胞凋亡, 这种作用具有剂量依赖性, 半数有效浓度(EC50)为15 $\mu$ M。Salubrinal在caspase-7加工过程中, 也抑制TM诱导的DNA断裂, ER应激激活caspase-7。然而, Salubrinal不是一般的凋亡抑制剂。Salubrinal作用于PC12细胞, 快速且强效诱导eIF2 $\alpha$ 磷酸化及其下游效应, 包括下调cyclin D1和上调GADD34和CHOP, eIF2 $\alpha$ 磷酸化诱导GADD34和CHOP这两种蛋白质的表达。Salubrinal通过抑制PP1/GADD34复合体, 而抑制eIF2 $\alpha$ 去磷酸化。Salubrinal通过抑制eIF2 $\alpha$ 去磷酸化, 而抑制HSV复制, IC50为3 $\mu$ M。Salubrinal增强非快速眼动(NREM)睡眠。				
体内研究	Salubrinal处理小鼠角膜感染的模型, 抑制HSV复制。与对照组比, Salubrinal局部处理, 显著降低感染动物眼拭子中恢复的病毒滴度。Salubrinal脑室内给药处理, 显著改变稳态睡眠响应。				
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	N/A

细胞实验	
细胞系	PC12
浓度	0-100 $\mu$ M

处理时间	48小时
方法	PC12细胞按每孔5000个接种在383孔板中，孔中为含3µg/ml TM的40µl无酚红培养基，诱导ER应激。通过自动化针转移将100nL DiverSet E(5mg/ml in DMSO)或美国国家癌症研究所(NCI)结构多样性设置和开放性收集(10mM, 溶于DMSO)(NCI)加入到孔中。48小时后，通过发光ATP实验测定细胞活力。每组实验板上DMSO和zVAD.fmk处理的孔分别作为阴性和阳性对照，缓解ER应激诱导的ATP损耗。

动物实验	
动物模型	8周大的雄性CD-1远交系小鼠
配制	溶于DMEM
剂量	75µM
给药方式	角膜上滴定

### 参考文献：

1. Boyce M, et al. Science. 2005, 307(5711), 935-939.
2. MethipparamM, et al. Am J Physiol Regul Integr Comp Physiol. 2009, 296(1), 178-184.
3. Methippara M, Neuroscience. 2012, 209, 108-118.

### 包装清单：

产品编号	产品名称	包装
SC4377-10mM	Salubrinal (eIF2α去磷酸化抑制剂)	10mM×0.2ml
SC4377-5mg	Salubrinal (eIF2α去磷酸化抑制剂)	5mg
SC4377-25mg	Salubrinal (eIF2α去磷酸化抑制剂)	25mg
—	说明书	1份

### 保存条件：

-20°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°C保存，预计6个月有效。

### 注意事项：

- 本产品对人体有刺激性，操作时请小心，并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成高浓度的储备液(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 2018.12.11