

产品名称：VR23
产品别名：VR23

生物活性:

Description	VR23 是一种有效的 proteasome 抑制剂，作用于胰蛋白酶样蛋白酶体，糜蛋白酶样蛋白酶体，和胰凝乳蛋白酶样蛋白酶体的 IC₅₀ 分别为 1 nM, 50-100 nM, 和 3 μM。				
IC ₅₀ & Target	Trypsin-like proteasomes[1] (in HeLa cells)	Chymotrypsin-like proteasomes[1] (in HeLa cells)	Caspase-like proteasomes [1] (in HeLa cells)		
	1 nM	100 nM	3 μM		
In Vitro	在 HeLa 细胞中, VR23 诱导泛素化蛋白质积累。在 RPMI 8226 和 KAS 6 细胞中, VR23 抑制细胞生长, IC ₅₀ 分别为 2.94 和 1.46 μM。VR23 对 bortezomib (BTZ)-敏感的和耐药的 RPMI 8226 与 ANBL6 细胞同样有效。在上述细胞中, 与 bortezomib 结合使用时, VR23 对细胞生长抑制表现出协同作用。此外, VR23 通过引起泛素化细胞周期素 E 积累选择性诱导癌细胞凋亡。[1]				
In Vivo	在接种 MDA-MB-231 转移性乳腺癌细胞的 ATH490 无胸腺小鼠中, VR23 (30mg/kg, i.p.)表现出有效的抗肿瘤和抗血管生成活性。在小鼠中, VR23 也会减少紫杉醇引起的副作用。[1]				
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO (warmed with 50°C water bath): 31 mg/mL (64.87 mM) Water (warmed with 50°C water bath): 5 mg/mL (10.46 mM) Ethanol: Insoluble				
	Preparing Stock Solutions	<div><div>Solvent</div><div>Mass</div><div>Concentration</div></div>	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.0926 mL	10.4629 mL	20.9258 mL
		5 mM	0.4185 mL	2.0926 mL	4.1852 mL
		10 mM	0.2093 mL	1.0463 mL	2.0926 mL
		50 mM	0.0419 mL	0.2093 mL	0.4185 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。 -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。				
References	1) Pundir S, et al. Cancer Res. 2015, 75(19), 4164-4175.				

实验参考:

Cell Assay	细胞实验: [1] Cell lines: RPMI 8226, KAS 6, 184B5, 和 MCF10A 细胞; 耐-bortezomib 的 RPMI 8226 细胞和耐-bortezomib 的 ANBL6 细胞 Concentrations: ~20 μM Incubation Time: -- Method: 进行克隆和 SRB 试验。IC ₅₀ 值使用 S 形剂量响应曲线(可变斜率)通过 Graph Pad Prism V 4.02 版进行计算。
	动物实验: [1] Animal Models: 移植 MDA-MB-231 或 RPMI 8226 癌细胞的 ATH490 无胸腺小鼠 Formulation: 含 10% DMSO, 12.5% Cremophor, 12.5% 乙醇, 和 65%生理盐水的稀释剂

	Dosages: 30mg/kg Administration: i.p.
Kinase Assay	蛋白酶体试验: [1] 在 96 孔聚合板上以指数生长的细胞用不同浓度的药物或空白对照处理 6 小时。用 0.5% NP40 缓冲液提取的蛋白酶体与等量样品在 100 μ L 总体积中混合, 然后与 25 μ mol/L 荧光底物(特异性 LRR 用于测定胰蛋白酶样活性, 特异性 LLE 用于测定半胱天冬酶活性, 特异性 SUVY 用于测定糜蛋白酶样活性)在黑底 96 孔板中于 37°C 下培育。荧光性在 360 nm (激发) 和 480 nm (发射)波长下每 5 分钟监测一次。
References	[1] Pundir S, et al. Cancer Res. 2015, 75(19), 4164-4175.



源叶生物