

cAMPS-Sp, triethylammonium salt

产品信息

产品名称	产品编号	规格
cAMPS-Sp, triethylammonium salt	53322ES03	1 mg

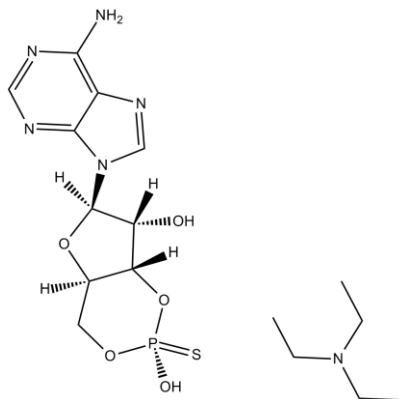
产品描述

cAMPS-Sp, triethylammonium salt 是 cAMP 的类似物，作为 PKA I 和 PKA II 活化的有效的竞争性拮抗剂。其相对应的 K_i 分别为 12.5 μM 和 4.5 μM 。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	Rp-cAMPS
靶点 (Target)	PKA I; PKA II
通路 (Pathway)	Protein Tyrosine Kinase--PKA
CAS 号 (CAS NO.)	73208-40-9
分子式 (Formula)	$\text{C}_{10}\text{H}_{12}\text{N}_5\text{O}_5\text{PS} \cdot \text{C}_6\text{H}_{15}\text{N}$
分子量 (Molecular Weight)	446.46
外观 (Appearance)	粉末

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于 -20°C ，有效期 3 年。建议分装后 -20°C 干燥保存，避免反复冻融。

注意事项

1. 为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。
2. 粉末溶解前请先短暂离心，以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途，禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

(一) 细胞实验 (体外实验)

实验通过对纯化和重组的猪心II型 cAMP 依赖性蛋白激酶全酶中 $[3H]cAMP$ 的置换能力的测定, 对比了腺苷 3', 5'-(环)硫代磷酸酯非对异构体 Sp-cAMP[S]和 Rp-cAMP[S]与环 AMP (cAMP)结合位点亲和力的影响。在有激活剂、无拮抗剂和拮抗剂浓度增加的情况下进行实验, 结果表明, Rp-cAMP[S]对 V_{max} 没有影响, 增加了激动剂活化的 EC_{50} 值, 对活化的协同性(h)没有影响。测定了 Rp-cAMP[S]抑制 cAMP 诱导的纯化 II 型 cAMP 依赖性蛋白激酶活化的 K_i 值为 $11 \mu M$ 。在非变性条件下, 在非对映异构体饱和浓度存在下, 聚丙烯酰胺凝胶上的全酶电泳导致亚单位与 Sp-cAMP[S]100%解离, 与 Rp-cAMP[S]0%解离。Sp-cAMP[S]是一种具有轴向外环硫原子的同分异构体, 它与全酶结合, 释放催化亚基并激活磷酸转移酶活性。Rp-cAMP[S]是一种具有赤道外环硫原子的同分异构体, 调节亚基结合而不解离激酶全酶来阻止 PKA 激活, 结果显示, Rp-cAMP[S]是磷酸转移酶活性的竞争性抑制剂。^[1]

(二) 动物实验 (体内实验)

本研究探讨 PKA、PKC 和 ERK 在 CeLC 中的作用。所有实验均采用成年雄性 Sprague-Dawley 大鼠。在正常大鼠和使用高岭土/卡拉胶诱导的单发性关节炎大鼠 (诱导后 6 h) 的脑片中对 CeLC 神经元进行全细胞膜片钳记录。实验结果表明 Rp-cAMP[S] ($10 \mu M, 15 \text{ min}$)可降低关节炎大鼠脑片 PB-CeLC 和 BLA-CeLC 突触诱发的单突触 EPSCs, 但对正常动物对照神经元无影响。Rp-cAMP 的抑制作用与在相同神经元中获得的前药(ACSF)对照值相比是显著的。PKA 和 ERK 通过独立的信号通路增加 NMDA 受体的功能, 从而促进疼痛相关的突触易化和行为。^[2]

参考文献

- [1] Rothermel JD, et al. A mechanistic and kinetic analysis of the interactions of the diastereoisomers of adenosine 3',5'-(cyclic)phosphorothioate with purified cyclic AMP-dependent protein kinase. *Biochem J.* 1988 May 1;251(3):757-62.
- [2] Fu Y, et al. PKA and ERK, but not PKC, in the amygdala contribute to pain-related synaptic plasticity and behavior. *Mol Pain.* 2008 Jul 16; 4:26.