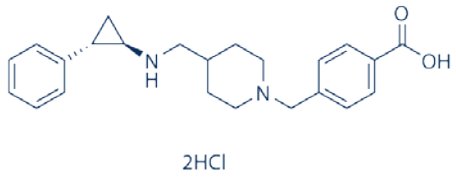


## GSK-2879552 ; GSK2879552

产品编号：MB3156  
 质量标准：>98%,BR  
 包装规格：5MG;25MG  
 产品形式：powder

### 基本信息

分子式	C23H28N2O2·2HCl	结 构 式	 <p>2HCl</p>
分子量	437.4		
CAS No.	1401966-69-5		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 29 mg/mL (66.3 mM)		
	Water : 44 mg/mL (100.59 mM)		
	Ethanol : Insoluble		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

**简介：** GSK2879552 是一种可口服的，不可逆的 **LSD1** 抑制剂，具有抗肿瘤活性。

### 物理性状及指标：

外观：.....白色至米色粉末

溶解性：.....Water 44 mg/mL (100.59 mM);DMSO 29 mg/mL (66.3 mM);Ethanol Insoluble

含量：.....>98%

**储存条件：** -20°C，避光防潮密闭干燥

### 生物活性

产品描述	GSK2879552 是一种有效的、选择性的、具有生物口服活性的、不可逆的 LSD1 的抑制剂， Kiapp=1.7 μM。
靶点	LSD1 (Cell-free assay) 1.7 μM(Ki)
体外研究	在被检测的 165 个细胞系中，GSK2879552 抑制了 9/28 的小细胞癌肿瘤细胞的生长，以及 20/29 的 AML 细胞系的生长，其抑制效率在 40%到 100%之间。被 GSK2879552 抑制的 SCLC 细胞系都表现出了 DNA 高甲基化探针的特性。
体内研究	在含有 SCLC 肿瘤的小鼠中，GSK2879552 (1.5 mg/kg, p.o.)表现出了 17%-83%的肿瘤生长抑制效应。

### 美仑相关产品推荐

MB5639	ORY-1001 (LSD1-IN-1 抑制剂)
--------	--------------------------

**用途及描述：** 科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。GSK2879552 是一种可口服的，不可逆的 **LSD1** 抑制剂，具有抗肿瘤活性。可用于相关领域的科研实验。

### 储液配置

体 积 水 量 浓 度	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2862 mL	11.4312 mL	22.8624 mL
5 mM	0.4572 mL	2.2862 mL	4.5725 mL
10 mM	0.2286 mL	1.1431 mL	2.2862 mL
50 mM	0.0457 mL	0.2286 mL	0.4572 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

激酶实验：	LSD1 酶学测试: LSD1 的活性用辣根过氧化物酶偶联试验进行测定。产物的形成量用 Ex 531 nm 和 Em 595 nm 下荧光强度进行测量。反应条件包括：5 nM LSD1，2.5 μM H3K4me2 多肽，50 mM HEPES pH 7，1 U/ml HRP，1 mM CHAPS，0.03% dBSA 以及 10 μM 的 amplex red。
细胞实验：	Cell lines: 165 种人源肿瘤细胞系 Concentrations: ~10 μM Incubation Time: 6 d Method: 所有细胞系最优的接种方法是接种到 384 孔板中来测定 6 天的增殖情况。细胞培养 24 小时达到最优的接种密度，然后用不同浓度的 GSK2879552 或者 0.15% DMSO 进行处理。培养皿在 37°C，5% CO2 条件下培养 6 天。然后用 CellTiter-Glo 将细胞裂解 其化学发光信号用 TECAN Safire2 酶标仪进行测量。同时，未经处理的细胞在刚加入化合物时收获作为细胞起始数目的标准。六天后 CTG 值可以得到。利用四维方程得到的数据来计算相应的 IC50 值。
动物实验：	Animal Models: 携带有 SCLC 肿瘤的小鼠 Dosages: 1.5 mg/kg Administration: 1.5 mg/kg

**【注意】**

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

### 活性化合物操作注意事项

**1 产品分装：**您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

**2 储备液制备：**大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

**3 细胞培养工作液制备：**请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。

灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

**4 体内动物实验应用：**由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg) = 动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数 / 动物 A 的 Km 系数

### 5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。