

AZD2858

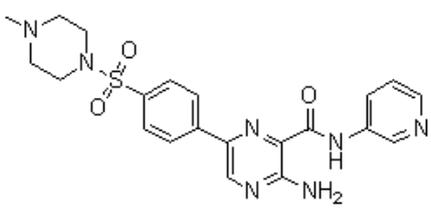
产品编号：MB3738

质量标准：>98%，选择性的 GSK-3 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;100MG

产品形式：粉状

基本信息

分子式	C ₂₁ H ₂₃ N ₇ O ₃ S	结 构 式	
分子量	453.52		
CAS No.	486424-20-8		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 7 mg/mL (15.43 mM) Water Insoluble 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：AZD2858 是一种有效的，可口服的 GSK-3 抑制剂，可以抑制 GSK-3 α 和 GSK-3 β 的活性，可用于骨折愈合的研究。

别名：AZD 2858;AZD-2858 ; 3-amino-6-(4-((4-methyl-1-piperazinyl)sulfonyl)phenyl)-n-3-pyridinyl-pyrazinecarboxamide

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色粉末

溶解性：.....DMSO : 7 mg/mL (15.43 mM) ; Water Insoluble ; 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	AZD2858 一种选择性的 GSK-3 抑制剂，IC ₅₀ 为 68 nM，激活 Wnt 信号通路，增强大鼠的骨质。
靶点	GSK-3 68 nM
体外研究	AZD2858 是选择性的 GSK-3 抑制剂，IC ₅₀ 是 68 nM，抑制 tau 396 位点的磷酸化，激活 Wnt 信号通路。AZD2858 处理(1 μ M, 12 h)分离的人成骨细胞导致 β -catenin 水平增加 3 倍。

	在人和大鼠的间充质干细胞中，AZD2858 引起 β -catenin 稳定，激活体外成骨细胞和成骨细胞钙化的 hADSC 定型。
体内研究	与对照组相比，大鼠口服 AZD2858 治疗两周后引起骨密度剂量依赖增加，治疗两周后，在每天 20 毫克/千克(总 BMC: 对照组的 172%)剂量下具有最大疗效。在皮层中也会发现小而显著的效果(总 BMC: 对照组的 111%)。AZD2858 处理大鼠(30 微摩尔/千克)三周后出现胫胫中矿物质密度(2 周时 28% ，三周时 38%)和矿物质含量(两周时 81% ，三周时 93%)增加。AZD2858 处理使骨折恢复更快，有骨性骨痂但没有明显的软骨成分。大鼠用 AZD2858 处理 28 天后，使血清中骨更新标志物和骨密度增加产生时间依赖性变化。大鼠用 AZD2858 处理 7 天后，骨形成标志 P1NP 增加，溶蚀标志物 TRAcP-5b 降低，这表明骨合成代谢增加，溶蚀作用减弱。

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3704	SB216763
MB4500	TDZD-8
MB3706	Tideglusib
MB3653	TWS119

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。AZD2858 是一种有效的，可口服的 GSK-3 抑制剂，可以抑制 GSK-3 α 和 GSK-3 β 的活性，可用于骨折愈合的研究。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2050 mL	11.0249 mL	22.0497 mL
5 mM	0.4410 mL	2.2050 mL	4.4099 mL
10 mM	0.2205 mL	1.1025 mL	2.2050 mL
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>Tau 磷酸化试验:</p> <p>表达 4-复制 Tau 的 NIH-3T3 细胞用作测定 AZD2858 活性的细胞系。细胞在含有 2 mM L-glut 和 10% HiFCS 的 DMEM 培养基上培养。以 6×10^5 细胞/孔的密度接种在 6 孔板上。每次实验中，AZD2858 的浓度分别是 1, 10, 100, 500, 1000, 2000 以及 10,000 nM，重复三次。细胞预处理 4 小时，用 100ul 裂解液(0.5% NP-40, 10 mM Tris, pH 7.2, 150 mM NaCl, 2 mM EDTA) 裂解。加入蛋白酶和磷酸酶抑制剂 (50 mM NaF, 0.2 mM NaVO₄ 和 Cocktail 蛋白酶抑制剂)</p>
-------------	---

	制成悬浮液，在- 80°C 冷冻至少 1 小时，在解冻并离心裂解前，根据标准的操作手册做免疫印迹分析。封闭以后，印迹暴露于第一抗体，Phospho-Ser396-tau (1:1000)过夜，漂洗，然后用第二抗体(驴抗兔，1:5000)培养，随后清洗。对于重新检测，使用第一抗体 Tau5 (1:200)和第二抗体辣根过氧化物酶连接的抗体（羊抗鼠，1:10000）。所有印迹通过 ECL 蛋白质印迹检测试剂盒，Kodak X-ray 胶片生成，用密度分析定量，计算 S396tau 和总 tau (tau5) 的比值。
细胞实验	<p>Cell lines: 人类脂肪衍生的干细胞和大鼠 MSCs</p> <p>Concentrations: ~20 mM</p> <p>Incubation Time: 24 小时</p> <p>Method: 人脂肪衍生的干细胞和大鼠 MSCs (分离自怀孕 8 周以上的 Sprague Dawley 大鼠骨髓) 在含有 5% FBS 和 2 mM GlutaMax 的 DMEM 培养基中生长。细胞以 3-5000 个细胞/孔的密度接种在含基础培养基的 96 孔板上，培养 18 小时后用 AZD2858 (0.3 nM 到 20 mM)处理。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 大鼠</p> <p>Formulation: 水中调节 PH 到 3.5</p> <p>Dosages: 30 微摩尔/千克/天</p> <p>Administration: 口服</p>

【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，否则会严重影响化合物活性，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，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，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。