

AS252424 ; AS-252424

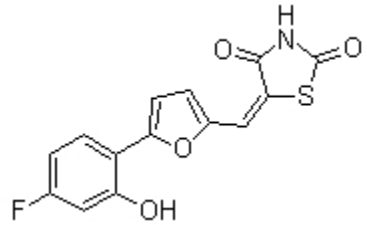
产品编号 : MB3878

质量标准 : >98% , 有效的 PI3K γ 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C14H8FNO4S	结构式	
分子量	305.28		
CAS No.	900515-16-4		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 61 mg/mL (199.81 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 : AS-252424 是一种有效的选择性 PI3K γ 抑制剂。

别名 : 5-[[5-(4-Fluoro-2-hydroxyphenyl)-2-furanyl]methylene]-2,4-thiazolidinedione

物理性状及指标 :

外观 :淡黄色至黄色固体

溶解性 :DMSO : 61 mg/mL (199.81 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	AS-252424 是新型, 有效的 PI3K γ 抑制剂, IC ₅₀ 为 30 nM, 作用于 PI3K γ 比作用于 PI3K α 选择性高 30 倍, 对 PI3K δ/β 具有低的抑制活性。		
靶点	PI3K γ	CK2 (casein kinase 2)	PI3K α
IC₅₀	33 nM	20 nM	935 nM
体外研究	AS-252424 是一种咪喃-2-亚甲基噻唑烷二酮, 作为一种选择性的 ATP 竞争性 PI3K γ 抑制剂, IC ₅₀ 为 33 nM。AS-252424 对 PI3K α 表现出降低的效力, IC ₅₀ 为 935 nM。对 80 种不同 Ser/Thr 和 Tyr 激酶进行筛选时, AS-252424 在 10 μ M 下, 除了 CK2, 不会对它们中的任何一个表现出显著的抑制作用。AS-252424 以浓度依赖的方式抑制 C5a 介导的 PKB/Akt 磷酸化, 具有亚微摩尔或低-微摩尔的 IC ₅₀ 值。AS-252424 浓度依赖性抑制 MCP-1 介导的趋药性, 在野生型原代单核细胞和单核细胞系 THP-1 中 IC ₅₀ 值分别为 52 μ M 和 53 μ M。通过细胞计数评估, AS252424 特异性阻断胰腺癌细胞系 HPAF 和 Capan1 的细胞分化。一项最近的研究表明, 100 nM AS-252424 显著减少 HL-1 心肌细胞中 [Ca ²⁺] _i , I _{Ca} 和 Ca ²⁺ 的瞬变现象。		
体内研究	AS-252424 以 10 mg/kg 口服给药导致中性粒细胞积聚(35%)适度减少, 几乎与 PI3K γ 缺失的小鼠体内观察到的结果一致。		

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)

MB3880	AS-604850
MB3879	AS-605240
MB3572	CAY10505
MB5316	CZC24832
MB8065	TG100-115

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。AS-252424 是一种有效的选择性 **PI3Ky** 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	3.2757 mL	16.3784 mL	32.7568 mL
5 mM	0.6551 mL	3.2757 mL	6.5514 mL
10 mM	0.3276 mL	1.6378 mL	3.2757 mL
50 mM	0.0655 mL	0.3276 mL	0.6551 mL

经典实验操作（仅供参考）

激酶实验：	体外 PI3Ky 激酶试验： 人 PI3Ky (100 ng)在室温下与激酶缓冲液(10 mM MgCl ₂ ，1 mM β-甘油磷酸盐，1 mM DTT，0.1 mM Na ₃ VO ₄ ，0.1% 胆酸钠和 15 M ATP/100 nCi γ[³³]ATP，终浓度)，包含 18 M PtdIns 和 250 M PtdSer (终浓度)的脂囊泡，以及 AS-252424 或 DMSO 进行培养。激酶反应通过加入 250 g Neomycin 包被的闪烁迫近分析(SPA)珠停止。
细胞实验：	Cell lines: Raw-264 巨噬细胞 Concentrations: 0.01 nM 到 0.1 μM Incubation Time: 5 分钟 Method: 在无血清培养基中饥饿培养 3 小时后，Raw-264 巨噬细胞用 AS-252424 或 DMSO 预处理 30 分钟，并用 50 nM C5a 刺激 5 分钟。PKB/Akt 磷酸化使用磷酸-Ser-473 Akt 特异性抗体和标准 ELISA 协议进行监测。
动物实验：	Animal Models: 对雌性 C3H 小鼠腹腔注射巯基乙酸盐(40 ml/kg)以诱导产生腹膜炎小鼠模型 Formulation: AS-252424 溶解于载体(0.5% 羧甲基纤维素/0.25% Tween-20)，并将溶液调节为 10 mL/kg 体重。 Dosages: 10 mg/kg Administration: Oral administration 15 minutes before injection of thioglycollate

【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。