

AS605240 ; AS-605240

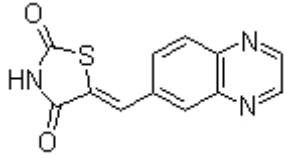
产品编号 : MB3879

质量标准 : >98% , 选择性的 PI3K γ 抑制剂

包装规格 : 10MG;50MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C12H7N3O2S	结 构 式	
分子量	257.27		
CAS No.	648450-29-7		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 0.4 mg/mL (1.55 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-605240 是一种口服有效的特异性 PI3K γ 抑制剂。

别名 : 5-(6-Quinoxalinylmethylene)-2,4-thiazolidinedione

物理性状及指标 :

外观 :棕色至红色固体

溶解性 :DMSO : 0.4 mg/mL (1.55 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-605240 选择性抑制 PI3K γ , IC ₅₀ 为 8 nM,作用于 PI3K γ 比作用于 PI3K δ/β 和 PI3K α 选择性分别高 30 和 7.5 倍以上。			
靶点	PI3K γ	PI3K α	PI3K β	PI3K δ
IC₅₀	8 nM	60 nM	270 nM	300 nM
体外研究	AS-605240 抑制 PI3K γ , IC ₅₀ 为 8 nM。AS-605240 是 PI3K γ 的 ATP 竞争性抑制剂, Ki 值为 7.8 nM。AS-605240 也抑制 PI3K $\alpha, \beta,$ 和 $\delta,$ IC ₅₀ 分别为 60, 270, 和 300 nM。AS-605240 抑制 C5a 调节的 PKB 磷酸化, IC ₅₀ 为 90 nM。1 μ M AS-605240 作用于骨髓单核细胞(BMDMs), 抑制 MCP-1 或 CSF-1 诱导的 PKB 磷酸化。100 nM AS-605240 作用于鼠的 SC-CA1 突触, 消除 NMDAR LTD, 不会影响 mGluR LTD, 和 LTP。			
体内研究	AS-605240 作用于 RANTES 诱导的患腹膜炎鼠模型, 降低中性粒细胞趋化性, ED ₅₀ 为 9.1 mg/kg。AS-605240 按 50 mg/kg 剂量作用于 α CII 诱导的关节炎, 保护其免受 α CII-IA 症状。AS-605240 按 50 mg/kg 剂量作用于胶原诱导的关节炎鼠模型, 也抑制关节炎和损伤。AS-605240 按 10 mg/kg 剂量作用于肥胖症诱导的糖尿病 ob/ob 鼠模型, 降低血糖水平, 明显提高胰岛素敏感性和葡萄糖耐量, 且不会影响体重。AS-605240 按 30 mg/kg 剂量处理显示出更好的效果, 只是稍微影响体重。而且, AS-605240 降低 ATMs 量和 MCP-1 循环水平。			

特征 AS-605240 是最有效的新型 PI3K γ 选择性抑制剂。

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
MB3878	AS-252424
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。AS605240 是高效选择性 PI3K γ 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	3.8870 mL	19.4348 mL	38.8697 mL
5 mM	-	-	-
10 mM	-	-	-
50 mM	-	-	-

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>体外 PI3K 油脂激酶实验：</p> <p>(1)测定 PI3Kγ: 100 ng 人类 PI3Kγ 和激酶 buffer(10 mM MgCl₂,1 mM β-甘油磷酸盐,1 mM DTT,0.1 mM Na₃VO₄,0.1% Na Cholate , 及 15 μM ATP/100 nCi γ[³³P]ATP)和含 18 μM PtdIns 与 250 μM PtdSer 的脂质囊泡, 在有 AS-605240 或 DMSO 存在时, 在 RT 中温育处理。加入 250 μg Neomycin 包被的闪烁逼近分析(SPA)珠终止激酶反应。(2) 测定 PI3Kα,β, 和 δ:不同量的 ATP 和不同纯化的 PI3K 亚型及浓度饱和的 PtdIns 温育。因此,测定 PI3Kα,β和 δ 的 IC₅₀ 值, 用于评估抑制剂选择性: 60 ng PI3Kα 和激酶 buffer (与 PI3Kγ 的激酶 buffer 类似, 但是不含 89 μM ATP/300 nCi γ[³³P]ATP, 也没有 Na Cholate)和含 212 μM PtdIns 与 58 μM PtdSer 的脂质囊泡在 RT 中温育。100 ng PI3Kβ 和激酶 buffer(含 70 μM ATP/300 nCi γ[³³P]ATP, 4 mM MgCl₂, 没有 Na Cholate)和含 225 μM PtdIns 与 45 μM PtdSer 的脂质囊泡在 RT 中温育。90 ng PI3Kδ 和激酶 buffer (含 65 μM ATP/300 nCi γ[³³P]ATP,1 mM MgCl₂, 没有 Na Cholate)和含 100 μM PtdIns 与 170 μM PtdSer 的脂质囊泡在 RT 中温育。2 小时后终止反应。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: RAW264 巨噬细胞</p> <p>Concentrations: 1 nM-10 μM,溶于 DMSO</p> <p>Incubation Time: 30 分钟</p> <p>Method:</p> <p>在无血清培养基上饥饿处理 3 小时后 细胞用 AS-605240 或 DMSO 预处理 30 分钟 然后用 50 nM C5a 刺激 5 分钟。使用 Ser473 位点磷酸化的 Akt 特定抗体和标准 ELISA 法监测 PKB 磷酸化。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: RANTES 诱导的患腹膜炎的雌性 Balb/C 或 C3H 鼠模型 ,αCII 诱导</p>

的患关节炎和胶原诱导的患关节炎的雄性 DBA/1 鼠模型

Formulation: 溶于 0.5%羧甲基纤维素/0.25% Tween-20

Dosages: 50 mg/kg

Administration: 口服处理

【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，请选择用合适溶剂 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。