

AS604850 ; AS-604850

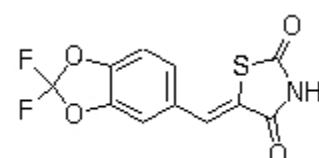
产品编号 : MB3880

质量标准 : >98% , PI3Ky 抑制剂

包装规格 : 5MG;25MG;100MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C11H5F2NO4S	结 构 式	
分子量	285.22		
CAS No.	648449-76-7		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 57 mg/mL (199.84 mM)		
	Water Insoluble		
	Ethanol : 5 mg/mL (17.53 mM)		
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 : 本品是一个选择性 PI3Ky 抑制剂。

别名 : 5-(2,2-Difluoro-benzo[1,3]dioxol-5-ylmethylene)-thiazolidine-2,4-dione, PI3Ky inhibitor

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 57 mg/mL (199.84 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol : 5 mg/mL (17.53 mM)

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-604850 是选择性的, ATP 竞争性 PI3Ky 抑制剂, IC50 为 250 nM, 作用于 PI3Ky 比作用于 PI3Kδ/β 选择性高 80 倍以上, 作用于 PI3Ky 比作用于 PI3Kα 选择性高 18 倍。	
靶点	PI3Ky	PI3Kα
IC50	0.25 μM	4.5 μM
体外研究	AS-604850 是一种 ATP 竞争性 PI3Ky 抑制剂, K _i 值为 0.18 μM。AS-604850 是 PI3Ky 亚型的选择性抑制剂, 选择性是 PI3Kδ 和 β 的 30 倍, 是 PI3Kα 的 18 倍 (PI3Kα: IC50 = 4.5 μM, PI3Kδ 和 β: IC50 > 20μM)。AS-604850 能够抑制 RAW264 小鼠巨噬细胞中 C5a-介导的 PKB 磷酸化, IC50 为 10 μM。AS-604850 浓度依赖性阻断 Pik3cg ^{+/+} 单核细胞中 MCP-1 介导的趋药性, IC50 为 21 mM, 但是不影响 Pik3cg ^{-/-} 细胞中的趋药性, 表明 AS-604850 通过 PI3Ky 发挥作用。AS-604850 减少大鼠肝细胞中甘氨酸鹅脱氧胆酸钠(GCDC)诱导的 Akt 磷酸化和细胞凋亡。在 HepG2 Ntcp 和 Huh7-Ntcp 细胞中, AS-604850 减少胆汁盐诱导的细胞凋亡。AS604850 浓度依赖性抑制 EoL-1 细胞和血液噬酸细胞对血小板激活因子(PAF)的趋药响应。	

体内研究	AS-604850 降低 RANTES 诱导的腹膜中性粒细胞聚集, ED50 为 42.4 mg/kg。在巯基乙酸盐诱导的腹膜炎模型中, 10 mg/kg AS-604850 口服给药导致中性粒细胞减少 31%。
-------------	--

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)

MB3879	AS-605240
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。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	3.5061 mL	17.5303 mL	35.0607 mL
5 mM	0.7012 mL	3.5061 mL	7.0121 mL
10 mM	0.3506 mL	1.7530 mL	3.5061 mL
50 mM	0.0701 mL	0.3506 mL	0.7012 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验:	<p>体外 PI3Ky 激酶试验: 人 PI3Ky (100 ng)在室温下与激酶缓冲液(10 mM MgCl₂, 1 mM β-甘油磷酸盐, 1 mM DTT, 0.1 mM Na₃VO₄, 0.1% 胆酸钠和 15 M ATP/100 nCi γ[³³]ATP, 终浓度)和包含 18 M PtdIns 与 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 新霉素-包被的闪烁逼近分析(SPA)珠停止。</p>
细胞实验:	<p>Cell lines: HepG2 Ntcp 和 Huh7-Ntcp 细胞 Concentrations: 2.5 μM Incubation Time: 2 - 4 小时 Method: 肝细胞培养物用稀释剂(DMSO), 25 μM TLC, 250 μM TCDC, 50 μM GCDC, 或 50 ng/ml Fas 处理 2-4 小时, HepG2-Ntcp 和 Huh7-Ntcp 细胞用 DMSO, 20 μM TLC, 75 μM TCDC 或 GCDC, 200 μM etoposide 或 200 ng/ml TNFa 和 28 ng/ml actinomycin D 处理 2-4 小时。凋亡细胞数量使用荧光着色法测定, 并表示为细胞百分比。人细胞系中的细胞凋亡通过测定 caspase-3/-7 活性确定, 大鼠肝细胞中的细胞凋亡通过蛋白印迹法检测 caspase-3 的 17 kDa 蛋白裂解片段确定; 等量蛋白质负荷通过肌动蛋白的蛋白印迹监测。</p>
动物实验:	<p>Animal Models: RANTES(0.5 mg/kg 在 200 ml 生理盐水中)或巯基乙酸盐(40 ml/kg)腹腔注射到 C3H 小鼠, 以诱导产生腹膜炎小鼠模型。 Formulation: AS-604850 溶于载体(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: 对 RANTES 为 0, 1, 3, 10 或 30 mg/kg, 对巯基乙酸盐为 10</p>

mg/kg

Administration: 注射 RANTES 或巯基乙酸盐之前 30 或 15 分钟口服给药

【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。