

GSK1838705A

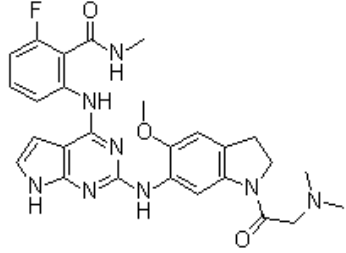
产品编号：MB3908

质量标准：>98%，IGF-1R 抑制剂

包装规格：5MG;10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C27H29FN8O3	结 构 式	
分子量	532.57		
CAS No.	1116235-97-2		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 107 mg/mL (200.91 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：GSK1838705A 是高效，可逆的 IGF-1R 和胰岛素受体 (insulin receptor) 抑制剂。

别名：Benzamide, 2-[[[2-[[1-[2-(dimethylamino)acetyl]-2,3-dihydro-5-methoxy-1H-indol-6-yl]amino]-7Hpyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-yl]amino]-6-fluoro-N-methyl

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 107 mg/mL (200.91 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	GSK1838705A 是有效的 IGF-1R 抑制剂，IC50 为 2.0 nM, 适度有效作用于 IR 和 ALK，IC50 分别为 1.6 nM 和 0.5 nM, 对其他蛋白激酶几乎没有作用活性。		
靶点	IGF-1R (Cell-free assay)	IR (Cell-free assay)	ALK (Cell-free assay)
IC50	2 nM	1.6 nM	0.5 nM

体外研究	GSK1838705A 有效且 ATP 竞争性抑制 IGF-1R 和 IR, $appK_i$ 值分别为 0.7 nM 和 1.1 nM。在细胞中, GSK1838705A 有效抑制配体诱导的 IGF-1R 和 IR 磷酸化, IC50 分别为 85 nM 和 79 nM。GSK1838705A 对一系列衍生自固体和血液肿瘤的细胞系, 比如 L-82, SUP-M2, SK-ES 和 MCF-7 细胞表现出显著的抗增殖作用, EC50 分别为 24 nM, 28 nM, 141 nM 和 203 nM。GSK1838705A 使 MCF-7 和 NCI-H929 细胞主要积累在细胞周期的 G1 (2N)期。GSK1838705A 也会抑制 ALK, K_i 为 0.35 nM, 抑制核仁磷酸蛋白(NPM)-ALK 融合细胞的增殖, EC50 为 24-88 nM。GSK1838705A 有效抑制 Karpas-299 和 SR-786 细胞中 NPM-ALK 磷酸化, 而对 STAT3 磷酸化仅有适度的作用。
体内研究	I 在负荷 NIH-3T3/LISN 肿瘤的小鼠体内, GSK1838705A (60 mg/kg)口服治疗抑制 77% 肿瘤生长, 而没有显著的体重损失。在负荷 COLO 205 肿瘤的小鼠体内, GSK1838705A (30 mg/kg)能够抑制 80%的肿瘤生长。此外, GSK1838705A 的抗肿瘤作用在负荷 HT29 异种植物或 BxPC3 异种植物的小鼠体内也能观察到。在小鼠体内, GSK1838705A (60 mg/kg)通过抑制 IR 信号, 引起血糖水平短暂增加 2 倍。GSK1838705A (60 mg/kg)抑制已建立的 Karpas-299 异种植物的生长, 抑制率为 93%, 而对大鼠的体重没有影响。
特征	一种 IGF-1R 和胰岛素受体的小分子抑制剂。

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)

MB3904	NVP-AEW541
MB3955	OSI-906 (Linsitinib)
MB3909	PQ401

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。GSK1838705A 是高效, 可逆的 IGF-IR 和胰岛素受体 (insulin receptor) 抑制剂。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.8777 mL	9.3884 mL	18.7769 mL
5 mM	0.3755 mL	1.8777 mL	3.7554 mL
10 mM	0.1878 mL	0.9388 mL	1.8777 mL
50 mM	0.0376 mL	0.1878 mL	0.3755 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	激酶试验: IGF-1R (氨基酸 957-1367)和 IR (氨基酸 979-1382)的胞内域，通过杆状病毒表达的谷胱甘肽 S-转移酶标记的蛋白质编码，用于均相时间分辨荧光试验测定 IC50s。过滤结合试验用于 appKi 测定，使用活化的 IGF-1R 和 IR 激酶进行。扩展的 GSK1838705A 的激酶选择性试验通过筛选 KinaseProfiler 组中的化合物进行。
细胞实验：	Cell lines: L-82, SUP-M2, SK-ES 和 MCF-7 Concentrations: 0 到 10 μ M Incubation Time: 72 小时 Method: 将细胞接种在 96 孔板，在 37 °C 下培养过夜，用 DMSO 或 GSK1838705A 处理 72 小时。对于 NIH-3T3/LISN 增殖试验，将细胞接种在胶原包被的 96 孔组织培养板，使其附着 24 小时。培养基用无血清培养基替换，细胞用 GSK1838705A 处理 2 小时。加入 IGF-I (30 ng/mL)后，细胞培养 72 小时。细胞增殖使用 CellTiter-Glo 发光细胞活力检测定量。IC50s 使用四参数曲线拟合软件包(XLfit4)根据细胞毒性曲线确定。
动物实验：	Animal Models: L-82, SUP-M2, SK-ES 和 MCF-7 细胞皮下注射到 CD1 或 SCID 小鼠的右侧。 Formulation: GSK1838705A 溶于 20% 磺丁基 β -环糊精(ISP; pH 3.5) Dosages: \leq 60 mg/kg Administration: 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。