

G007-LK

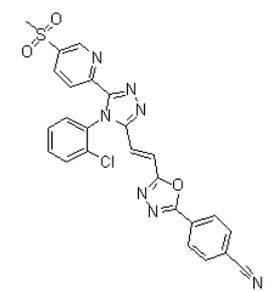
产品编号：MB4096

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG ; 100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C25H16ClN7O3S	结 构 式	
分子量	529.96		
CAS No.	1380672-07-0		
储存条件	常温，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (188.69 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：G007-LK 是一种有效的，选择性的 TNKS1 和 TNKS2 抑制剂。

别名：Benzonitrile, 4-[5-[(1E)-2-[4-(2-chlorophenyl)-5-[5-(methylsulfonyl)-2-pyridinyl]-4H-1,2,4-triazol-3-yl]ethenyl]-1,3,4-oxadiazol-2-yl]-

物理性状及指标：

外观：.....类白色至黄色固体

溶解性：.....DMSO : 100 mg/mL (188.69 mM) ; Water : Insoluble ; Ethanol : Insoluble

含量：.....>98%

储存条件：常温，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	G007-LK 是一种有效的选择性 tankyrase 抑制剂，对 TNKS1/2 的 IC50 分别为 46 nM 和 25 nM。
体外研究	G007-LK 减少 Wnt / β -catenin 信号通过防止聚(ADP-ribosyl)ation-dependent 轴蛋白降解，从而促进 β -catenin 扰动。G007-LK 完全块 ligand-driven Wnt / β -catenin 信号在细胞培养和显示大约 50%的抑制 APC 突变在大多数 CRC 细胞系驱动信号。G007-LK(0.2 μ M)减少了科罗拉多州的数量- 320 - dm 细胞有丝分裂从 24%提高到 12%,减少 HCT-15 细胞 s 阶段从

	28%降至 18%。抑制 CRC 系 COLO-320DM 和 SW403 的菌落形成。G007-LK 抑制类有机物生长，IC50 为 80 nM。
体内研究	G007-LK 在异种移植和基因工程 CRC 模型中显示出抗肿瘤功效。在 COLO-320DM 模型中，G007-LK 可降低 tankyrases 1 和 tankyrases 2 蛋白质水平，稳定 AXIN1 和 AXIN2，并降低 β -catenin 水平。在功效研究肿瘤中，Wnt / β -连环蛋白信号传导以剂量依赖性方式被明显抑制，如 β -连环蛋白激活基因 NKD1，APCDD1 和 TNFRSF19 (TROY) 的表达降低以及 β -表达增加所示。连环蛋白抑制基因 CLIC3。G007-LK 处理增加 COLO-320DM 肿瘤中 KRT20 和 TM4SF4 的表达。G007-LK (每天两次 20mg / kg) 实现 61%的肿瘤生长抑制。G007-LK 降低正常肠中的 Wnt / β -连环蛋白信号传导和细胞增殖。

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)

MB4095	NVP-TNKS656
--------	-------------

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。G007-LK 是一种有效的，选择性的 TNKS1 和 TNKS2 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	1.8869 mL	9.4347 mL	18.8693 mL
5 mM	0.3774 mL	1.8869 mL	3.7739 mL
10 mM	0.1887 mL	0.9435 mL	1.8869 mL
50 mM	0.0377 mL	0.1887 mL	0.3774 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>TNKS1 和 TNKS2 体外生化分析：</p> <p>G007-LK 在不同剂量(重复)下对 TNKS1、TNKS2 化学发光试剂盒的抑制活性进行了两次检测，并在 GloMax 发光计上测量其发光情况。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: APC-mutant CRC cell lines COLO-320DM</p> <p>Concentrations: ~0.2 μM</p> <p>Incubation Time: 7 to 13 days</p> <p>Method:</p> <p>对于集落形成试验，细胞在 2mL 培养基中以 500 个细胞/孔接种。用 0.06%二甲基亚砷或 0.06%二甲基亚砷中的化合物处理三份并的细胞系，培养 17 天或直到菌落变得足够大以定量，每三天更换培养基和化合物。将 200μL 的 12mM 3-(4,5-二甲基噻唑-2-基)-2,5-二苯基</p>

	四唑溴化物加入每个孔中 1 小时，对菌落进行染色，用 GelCount 扫描仪在 1200dpi 分辨率下定量菌落数。
动物实验	<p>Animal Models: Human APC –mutant CRC xenograft COLO-320DM</p> <p>Formulation: 15% DMSO, 17.5% Cremophor EL, 8.75% ethanol, 8.75% Miglyol 810N, 50% PBS</p> <p>Dosages: 20 mg/kg</p> <p>Administration: i.p. twice daily</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做好预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，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
狻狻	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。