

AR-A014418

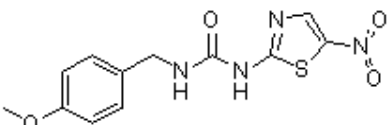
产品编号：MB4289

质量标准：>98%，GSK3 抑制剂

包装规格：10MG;50MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C12H12N4O4S	结 构 式	
分子量	308.31		
CAS No.	487021-52-3		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO：61 mg/mL (197.85 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：AR-A014418 是一种有效，选择性，ATP 竞争性的 GSK3 β 抑制剂。

别名：AR 0133418; GSK 3 β inhibitor VIII; AR 014418；

Urea, N-[(4-methoxyphenyl)methyl]-N'-(5-nitro-2-thiazolyl)-

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至黄色固体

溶解性：.....DMSO：61 mg/mL (197.85 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	AR-A014418 是一种 ATP 竞争性和选择性的 GSK3 β 抑制剂，无细胞试验中 IC ₅₀ 和 K _i 为 104 nM 和 38 nM，而对被测试的其他 26 种激酶没有显著抑制作用。	
特性	细胞渗透性 GSK3 选择性抑制剂。	
靶点	GSK-3 β	GSK-3 β

	(Cell-free assay)	(Cell-free assay)
	38 nM(Ki)	38 nM(Ki)
体外研究	在 3T3 成纤维细胞中, AR-A014418 抑制 GSK3 特定位点(丝氨酸 396) γ 蛋白磷酸化, 其 IC50 是 2.7 μ M, 进而保护 N2A 细胞免遭抑制 PI3K/PKB 信号通路引起的死亡。在海马切片中, AR-A014418 抑制由 β 样淀粉肽诱导的神经退化。在 NGP 细胞和 SH-5Y-SY 细胞中, AR-A014418 抑制神经内分泌标志物, 抑制神经瘤细胞的生长。	
体内研究	在 SOD1 蛋白 G93A 突变肌萎缩性脊髓侧索硬化症的小鼠模型中, 腹腔注射 AR-A014418 (0-4 mg/kg, i.p.)能够延长症状的发生, 增加肌肉活力, 减慢疾病发生。此外, AR-A014418 通过调节脊髓中的 NMDA 和代谢型受体信号通路和 TNF- α 和 IL-1 β 的释放来发挥对小鼠乙酸和甲醛诱导的伤害感受的抑制作用。	

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)

MB3724	AZD1080
MB4519	BIO-acetoxime
MB3793	GSK343

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。AR-A014418 是一种有效, 选择性, ATP 竞争性的 GSK3 β 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	3.2435 mL	16.2174 mL	32.4349 mL
5 mM	0.6487 mL	3.2435 mL	6.4870 mL
10 mM	0.3243 mL	1.6217 mL	3.2435 mL
50 mM	0.0649 mL	0.3243 mL	0.6487 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	<p>GSK3 闪烁逼近分析法:</p> <p>竞争性实验是在干净底部的孔板中用 10 个不同的浓度梯度重复两次来测定的。生物素标记的多肽 biotin-AAEELDSRAGS(PO3H2)PQL 以 2μM 的浓度加入到含有 6 单位的重组人 GSK3 (α 和 β 等量混合) 12 mM MOPS, pH 7.0, 0.3 mM EDTA, 0.01% β-mercaptoethanol, 0.004% Brij 35, 0.5% glycerol, 和 0.5 μg 牛血清蛋白/25 μl 中孵育 10-15 分钟。在 50mM Mg(Ac)2 中加入 0.04 μCi of [γ-33P]ATP 和未标记的 ATP, ATP 的终浓度是 1 μM, 反应体积是 25ul, 使</p>
-------------	---

	<p>反应开始进行。使用不加多肽底物作为空白对照。室温孵育 20 分钟以后，用含有 5 mM EDTA, 50 μM ATP, 0.1% Triton X-100, 以及 0.25 mg 链霉亲和素包被具有 35 pmol 的结合能力的珠子来终止反应。6 小时以后，用液体闪烁计数器测定放射性。用 GraphPad Prism 通过非线性回归来分析抑制曲线。</p>
细胞实验	<p>Cell lines: N2A 细胞 Concentrations: ~50 μM Incubation Time: 24 小时 Method: 细胞活性通过钙黄绿素和碘化吡啶摄入来测定。活细胞具有酯酶，能够将钙黄绿素摄入和排出，产生黄绿荧光。碘化吡啶只能被死细胞摄入，产生橘红色荧光。简单的说，N2A 细胞在体外培养 2 天，然后在 AR-A014418 或者载体(DMSO) 存在下用 50 μM LY-294002 处理 24 小时。然后，N2A 细胞在 2 μM PI 和 1 μM 钙黄绿素-AM 存在下孵育 30 分钟。随后培养基用包含 2 mM CaCl₂ 的 Hanks'缓冲盐溶液洗 3 次，细胞通过 Zeiss Axiovert 135 荧光显微镜进行观察。分析 3 个区域（随机挑选）至少 3 个不同实验中每孔的情况（大约 300 个细胞每个区域）。以 PI 染色阳性的细胞比上总的细胞的比值作为细胞死亡的百分比。在每次试验中，每次都是扣除空白对照中死亡的细胞数之后计算的。</p>
动物实验	<p>Animal Models: 携带 G93A 突变体人类 SOD1 的 ALS 小鼠模型。 Formulation: 生理盐水 Dosages: ~4 毫克/千克 Administration: 腹腔注射</p>

【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。

