

GSK2606414; GSK-2606414

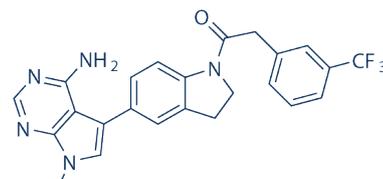
产品编号: MB4559

质量标准: >98%,BR

包装规格: 5MG; 25MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C ₂₄ H ₂₀ F ₃ N ₅ O	结构式	
分子量	451.44		
CAS No.	1337531-36-8		
储存条件	-20℃, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO 90 mg/mL (199.36 mM) Ethanol 21 mg/mL (46.52 mM) Water 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: GSK2606414 是一种口服具有生物活性的, 有效的, 选择性 **PERK** 抑制剂, **IC₅₀** 为 0.4 nM, 比测试的其他 EIF2AKs 选择性至少高 100 倍。

别名: 7Methyl-5-(1-([3-(trifluoromethyl)phenyl]acetyl)-2,3-dihydro-1H-indol-5-yl)-7H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-4-amine

物理性状及指标:

外观:白色或类白色粉末

溶解性:DMSO 90 mg/mL (199.36 mM);Ethanol 21 mg/mL (46.52 mM);Water Insoluble

含量:>98%

储存条件: -20℃, 避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	GSK2606414 是一种口服具有生物活性的, 有效的, 选择性 PERK 抑制剂, IC₅₀ 为 0.4 nM, 比测试的其他 EIF2AKs 选择性至少高 100 倍。
特性	The first PERK-selective inhibitor with good oral bioavailability and crosses the blood-brain barrier.
靶点	EIF2AK3 (PERK)

	(Cell-free assay)
	0.4 nM
体外研究	GSK2606414 抑制 A459 细胞中的 PERK 自磷酸化, IC50<0.3 μM。
体内研究	GSK2606414 在小鼠、大鼠和狗的体内研究中, 口服有效性高, 血液清除率低。在人体胰腺瘤 BxPC3 的小鼠移植模型中, 口服 GSK2606414 能够抑制肿瘤的生长, 呈现剂量依赖性。GSK2656157 还能够改变小鼠 BxPC3 肿瘤异种移植模型中的氨基酸代谢, 降低血管密度和血管灌注。

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)

MB4567	ISRIB(trans-isomer)
--------	---------------------

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。GSK2606414 是一种口服具有生物活性的, 有效的, 选择性 **PERK** 抑制剂。

储液配置

体 DMSO 质 量 浓度 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.2151 mL	11.0757 mL	22.1513 mL
5 mM	0.4430 mL	2.2151 mL	4.4303 mL
10 mM	0.2215 mL	1.1076 mL	2.2151 mL
50 mM	0.0443 mL	0.2215 mL	0.4430 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验	Animal Models: BxPC3 人胰腺瘤异种移植模型 Formulation: 0.5%羟丙基甲基纤维素, 0.1%水溶吐温 80 Dosages: ~150 mg/kg Administration: 口服
------	--

【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。

