

## GKT137831

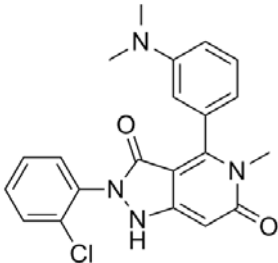
产品编号：MB5474

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG; 25MG

产品形式：浅黄色至黄色(固体)

### 基本信息

分子式	C21H19ClN4O2	结 构 式	
分子量	394.85		
CAS No.	1218942-37-0		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO 78 mg/mL warmed (197.54		
	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：**GKT137831 是一种新型特异性的 NADPH 氧化酶 (NOX1/4) 抑制剂。GKT137831 有效作用于人 Nox4 和 Nox1,  $K_i$  分别为  $140 \pm 40$  nM 和  $110 \pm 30$  nM, 而作用于 Nox2 和 Nox5,  $K_i$  分别为  $1750 \pm 700$  nM 和  $410 \pm 100$  nM。

**别名：**1H-Pyrazolo[4,3-c]pyridine-3,6(2H,5H)-dione,

2-(2-chlorophenyl)-4-[3-(dimethylamino)phenyl]-5-methyl

### 物理性状及指标：

外观：.....浅黄色至黄色(固体)

溶解性：.....DMSO 78 mg/mL warmed (197.54 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

<b>产品描述</b>	GKT137831 是一种有效的双 NADPH oxidase NOX1/NOX4 抑制剂， $K_i$ 分别为 110 nM 和 140 nM。对 NOX1、4、5 的选择性约为对 NOX2 的 10 倍，不抑制 XO 或 ROS/RNS。	
<b>靶点</b>	NOX1 (Cell-based assay)	NOX4 (Cell-based assay)
	110 nM( $K_i$ )	140 nM( $K_i$ )
<b>体外研究</b>	在 HPAECs 和 HPASMCs 中，GKT137831 减弱缺氧诱导的 H(2)O(2)释放，细胞增殖，和 TGF- $\beta$ 1 表达，并改善 PPAR $\gamma$ 表达减少。在人大动脉内皮细胞中，GKT137831 也会防止高血糖症应答产生的氧化应激。	
<b>体内研究</b>	在 WT 和 SOD1mut 小鼠体内，GKT137831 (60 mg/kg i.g.)阻断肝纤维化，并下调氧化应激，	

	炎症和纤维化的发生。在长期低氧环境下的小鼠模型中，GKT137831 (60 mg/kg/d p.o.)也会减弱长期缺氧诱导的右心室肥大,血管重构,肺细胞增生,以及低氧环境下肺 PPAR $\gamma$ 和 TGF- $\beta$ 表达的改变。在糖尿病载脂蛋白 E 不足的小鼠体内，GKT137831 (60 mg/kg/d p.o.)减弱糖尿病加速的动脉粥样硬化。此外，在注入 angII 的 c-hNox4Tg 小鼠体内，GKT137831 废止氧化应激的增加，抑制 Akt-mTOR 和 NF- $\kappa$ B 信号通路，并减弱心脏重塑。
--	---

**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。GKT137831 是一种有效的双 **NADPH oxidase NOX1/NOX4** 抑制剂。可用于相关领域的科研实验。

**储液配置**：

体 DMSO 质 量 浓度	积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5326 mL	12.6630 mL	25.3261 mL
5 mM	0.5065 mL	2.5326 mL	5.0652 mL
10 mM	0.2533 mL	1.2663 mL	2.5326 mL
50 mM	0.0507 mL	0.2533 mL	0.5065 mL

**经典实验操作 (仅供参考)**

<b>细胞实验</b>	<p><b>Cell lines:</b> 低氧 HPASMC 和 HPAECs</p> <p><b>Concentrations:</b> 20 <math>\mu</math>M</p> <p><b>Incubation Time:</b> 72 小时</p> <p><b>Method:</b></p> <p>低氧 HPASMC 和 HPAEC 增殖使用 MTT 法测定，通过 Western 印迹检测增殖细胞核抗原 (PCNA)表达，或台盼蓝着色后进行人工细胞计数。Amplex Red 过氧化氢/过氧化物酶检测试剂盒用于测量从 HPAECs 或 HPASMCs 释放到培养基的 H<sub>2</sub>O<sub>2</sub>。暴露于对照组或低氧环境下 72 小时后，加入 Amplex Red 试剂，荧光检测前，细胞恢复到对照组或低氧环境再培养 1 小时。</p>
<b>动物实验</b>	<p><b>Animal Models:</b> 肝纤维化小鼠模型</p> <p><b>Formulation:</b> 玉米油</p> <p><b>Dosages:</b> 每天 60 mg/kg</p> <p><b>Administration:</b> i.g.</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，使产品沉降到官底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，官底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定成了误差，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。