

GSK2982772

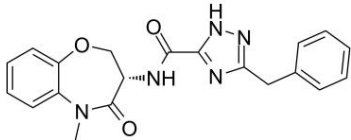
产品编号: MB5488

质量标准: >98%,BR

包装规格: 1MG/5MG

产品形式: solid

基本信息

分子式	C20H19N5O3	结 构 式	
分子量	377.40		
CAS No.	1622848-92-3		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 75 mg/mL (198.73 mM)		
	Ethanol: 30 mg/mL (79.49 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: GSK2982772 是 receptor-interacting protein-1 (**RIP1**) kinase (**RIPK1**)的 ATP 竞争性抑制剂, IC50 为 16 nM。它能够抑制多种 TNF 依赖性的细胞反应, 具有良好的激酶特异性和细胞活性。

物理性状及指标:

外观:粉末

溶解性:DMSO: 75 mg/mL (198.73 mM); Ethanol: 30 mg/mL (79.49 mM)

含量:>98%

生物活性 (仅来自于公开文献, 不保证其有效性)

描述	GSK2982772 是 receptor-interacting protein-1 (RIP1) kinase (RIPK1)的 ATP 竞争性抑制剂, IC50 为 16 nM。它能够抑制多种 TNF 依赖性的细胞反应, 具有良好的激酶特异性和细胞活性。
靶点	human RIP1 (Cell-free assay): 16 nM
体外	GSK2982772 在 RIP1 细胞系统中具有良好的活性作用, 阻止 TNF 诱导的坏死性细胞死亡; 在溃疡性结肠炎外植体中, 能够阻止自发的细胞因子释放。
体内	GSK2982772 对人源和猴源 RIP1 具有近乎相等的 RIP1 FP (fluorescence polarization) 效力, 但对非灵长类的 RIP1 的效力显著降低, 说明其对灵长类 RIP1 具有选择性。GSK2982772 具有良好的血液游离分数, 在大鼠中为 4.2%、在犬类中为 11%、在食蟹猴中为 11%、在人类中为 7.4%。在大鼠和猴子中, 该抑制剂具有良好的药代动力学特征。在多种组织中广泛分布, 包括结肠、肝脏、肾脏和心脏, 阻止浓度与血药浓度相似。然而, 尽管 GSK2982772 具有良好的细胞透性, 其在大鼠中的大脑渗透率低 (4%), 这可能与 GSK2982772 通过流出的药物转运体从大脑

中主动挤压出来有关。GSK2982772 具有较高的口服生物利用度，中低水平的清除率、中等分布体积，终末半衰期约为 12 小时。

Animal Models: TNF/zVAD 小鼠模型

Formulation: 生理盐水

动物实验:

Dosages: 3, 10, 50 mg/kg

Administration: 口服

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)

MB13420	番茄昔
MB5067	Necrostatin1
MB5489	GSK547

储液配置及储存: 按表中溶解性配置; 如溶解困难, 可以通过快速搅拌, 超声或温和加热 (在 45-60°C 下水浴)。液体稳定性报道的很少, 建议现配现用, 如需储存, 建议: -20°C 1-3 月; -80°C 3-6 月。

体 积 浓度	DMSO 质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.6497 mL	13.2485 mL	26.4971 mL
5 mM	0.5299 mL	2.6497 mL	5.2994 mL
10 mM	0.2650 mL	1.3249 mL	2.6497 mL
50 mM	0.0530 mL	0.2650 mL	0.5299 mL

【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。