

## GSK547

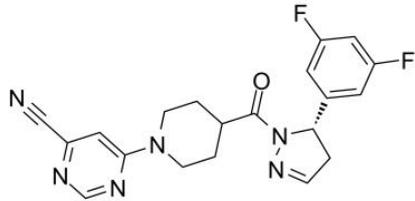
产品编号: MB5489

质量标准: >98%,BR

包装规格: 1MG/5MG

产品形式: solid

### 基本信息

分子式	C20H18F2N6O	结构式	
分子量	396.39		
CAS No.	2226735-55-1		
储存条件	-20°C, 避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO: 29 mg/mL (73.16 mM)		
	Ethanol: Insoluble		
	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:** GSK'547 是一种高度选择性、有效的 RIP1 (RIPK1)抑制剂, 在小鼠药代动力学研究中, 口服暴露量相比 GSK'963 提高 400 倍。

### 物理性状及指标:

外观: .....粉末

溶解性: .....DMSO: 29 mg/mL (73.16 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	GSK'547 是一种高度选择性、有效的 <b>RIP1 (RIPK1)</b> 抑制剂, 在小鼠药代动力学研究中, 口服暴露量相比 GSK'963 提高 400 倍。
靶点	RIP1
体外	在体外, GSK'547 的处理可指导骨髓来源的巨噬细胞发展成免疫原性表型, MHC-II, TNF $\alpha$ 和 IFN $\gamma$ 表达上调, 同时降低 CD206, IL-10 和 TGF $\beta$ 的表达。此外, GSK'547 还在骨髓来源的巨噬细胞中上调 STAT1 信号, 降低 STAT3、STAT5 和 STAT6 信号。经 GSK'547 处理的巨噬细胞拥有更强的捕捉抗原能力。
体内	让小鼠通过食物进行 GSK'547 给药, 在体内 GSK'547 的浓度在 24 小时内处于稳定水平, 高于在 L929 细胞中的 IC50 值。在持续 6 周的给药过程中, GSK'547 在体内可维持高浓度水平。

GSK'547 耐受性良好，没有明显的病理学特征。在具有原位胰腺导管腺癌的小鼠中，相较于对照组和 Nec-1s 处理组，GSK'547 可减少其肿瘤负荷并延长其生存时间。GSK'547 可防止已建立的肿瘤和肝转移。

**Cell lines:** L929 细胞

**Concentrations:** --

**细胞实验:** **Incubation Time:** 30 min

**Method:** 用不同浓度的 GSK'547 对细胞进行预处理，处理 30 分钟。24 小时后，通过检测系细胞内 ATP 水平检测细胞死亡。

**动物实验:**

- **Animal Models:** C57BL/6 小鼠
- **Formulation:** 通过混在食物中进行给药
- **Dosages:** 100 mg/kg/day
- **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	番茄苷
MB5067	Necrostatin1
MB5488	GSK2982772

**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	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	2.5228 mL	12.6138 mL	25.2277 mL
5 mM	0.5046 mL	2.5228 mL	5.0455 mL
10 mM	0.2523 mL	1.2614 mL	2.5228 mL
50 mM	0.0505 mL	0.2523 mL	0.5046 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。