



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **TG003**
CAS 号: **719277-26-6**
产品货号: **S86319**

生物活性:																									
Description	TG003 是一种高效的 Clk1/Sty 抑制剂, 抑制 Clk1 和 Clk4 的 IC50 值分别为 20 和 15 nM。																								
IC50 & Target[1]	CLK1 20 nM (IC ₅₀)	CLK2 200 nM (IC ₅₀)	CLK4 15 nM (IC ₅₀)																						
In Vitro	TG003 对 Clk1/Sty 和 Clk4 的作用最强 (IC50 为 15-20 nM), 对 Clk2 的作用较弱 (IC50 为 200 nM)。TG003 通过抑制 Clk 介导的磷酸化, 在体外抑制 SF2/ASF 依赖的 β-珠蛋白前 mRNA 剪接。它还能抑制哺乳动物细胞中富含丝氨酸/精氨酸的蛋白质磷酸化、核斑点解离以及 Clk1/Sty 依赖的选择性剪接[1]。 小分子药物 TG003 通过调节 TP53 内含子 9 的选择性剪接来增加 p53 β 和 p53 γ 蛋白异构体的内源性表达[2]。																								
In Vivo	鞘内注射 TG003 (1-100 pM) 或 IC261 (0.1-1 nM) 可剂量依赖性地降低角叉菜胶或 CFA 引起的机械异常性疼痛和热痛觉过敏[3]。																								
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (501.34 mM; 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) <table><tr><th rowspan="5">Preparing Stock Solutions</th><th> Solvent Mass Concentration </th><th>1 mg</th><th>5 mg</th><th>10 mg</th></tr><tr><td>1 mM</td><td>4.0107 mL</td><td>20.0537 mL</td><td>40.1075 mL</td></tr><tr><td>5 mM</td><td>0.8021 mL</td><td>4.0107 mL</td><td>8.0215 mL</td></tr><tr><td>10 mM</td><td>0.4011 mL</td><td>2.0054 mL</td><td>4.0107 mL</td></tr><tr><td></td><td></td><td></td><td></td></tr></table> *请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。 动物实验: 请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。 以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液, 再依次添加助溶剂: ——为保证实验结果的可靠性, 澄清的储备液可以根据储存条件, 适当保存; 体内实验的工作液, 建议您现用现配, 当天使用; 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比; 如在配制过程中出现沉淀、析出现象, 可以通过加热和/或超声的方式助溶 方案 一 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (8.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μL Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μL 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水				Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	1 mM	4.0107 mL	20.0537 mL	40.1075 mL	5 mM	0.8021 mL	4.0107 mL	8.0215 mL	10 mM	0.4011 mL	2.0054 mL	4.0107 mL				
Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg																					
	1 mM	4.0107 mL	20.0537 mL	40.1075 mL																					
	5 mM	0.8021 mL	4.0107 mL	8.0215 mL																					
	10 mM	0.4011 mL	2.0054 mL	4.0107 mL																					



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (8.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (8.34 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Muraki M, et al. Manipulation of alternative splicing by a newly developed inhibitor of Clks. J Biol Chem. 2004 Jun 4;279(23):24246-54. [2]. Marcel V, et al. Modulation of p53 β and p53 γ expression by regulating the alternative splicing of TP53 gene modifies cellular response. Cell Death Differ. 2014 Sep;21(9):1377-87. [3]. Kurihara T, et al. Alleviation of behavioral hypersensitivity in mouse models of inflammatory pain with two structurally different casein kinase 1 (CK1) inhibitors. Mol Pain. 2014 Mar 10;10:17.

完整储备液配制表:

请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液; 一旦配成溶液, 请分装保存, 避免反复冻融造成的产品失效。

储备液的保存方式和期限: -80°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 储存时, 请在 1 年内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	4.0107 mL	20.0537 mL	40.1075 mL	100.2687 mL
	5 mM	0.8021 mL	4.0107 mL	8.0215 mL	20.0537 mL
	10 mM	0.4011 mL	2.0054 mL	4.0107 mL	10.0269 mL
	15 mM	0.2674 mL	1.3369 mL	2.6738 mL	6.6846 mL
	20 mM	0.2005 mL	1.0027 mL	2.0054 mL	5.0134 mL
	25 mM	0.1604 mL	0.8021 mL	1.6043 mL	4.0107 mL
	30 mM	0.1337 mL	0.6685 mL	1.3369 mL	3.3423 mL
	40 mM	0.1003 mL	0.5013 mL	1.0027 mL	2.5067 mL
	50 mM	0.0802 mL	0.4011 mL	0.8021 mL	2.0054 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyw@sina.com

	60 mM	0.0668 mL	0.3342 mL	0.6685 mL	1.6711 mL
	80 mM	0.0501 mL	0.2507 mL	0.5013 mL	1.2534 mL
	100 mM	0.0401 mL	0.2005 mL	0.4011 mL	1.0027 mL



源叶