



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: GRP94; Grp94 Inhibitor-1
CAS 号: 2234897-35-7
产品货号: S87701

生物活性:						
Description	Grp94 Inhibitor-1 是一种有效的、选择性的 Grp94 抑制剂, IC50 值为 2 nM, 对 Grp94 的抑制作用是 Hsp90 α 的 1000 倍。					
IC50 & Target[1]	GRP94 2 nM (IC50)					
In Vitro	Grp94 Inhibitor-1 (1-5 μM; 36 小时) 以剂量依赖性方式显著下调 Panc1 细胞中整合素 α2 和整合素 αL 的细胞表面表达水平[1]。 Western Blot Analysis[1]					
	Cell Line:	Panc1 cells				
	Concentration:	1 μM; 2.5 μM; 5 μM				
	Incubation Time:	36 hours				
	Result:	Decreased integrin 伪2 and integrin 伪L protein expression.				
In Vivo	Grp94 Inhibitor-1 (腹腔内注射, 每日四次; 联合用药 10 mg/kg 或 30 mg/kg; 疗程 8 天) 不会减轻结肠缩短, 但会降低疾病活动指数 (DAI) 评分。它还能提高血清和结肠组织中的 TNF α 和 IL-6 水平, 并显著降低结肠组织中的 p65 表达, 尤其是在 30 mg/kg 剂量组[1]。					
	Animal Model:	C57BL/6 mice (male, 20-22 g)[1]				
	Dosage:	10 mg/kg or 30 mg/kg				
	Administration:	Intraperitoneal injection,qid.; coadminbistration 10 mg/kg or 30 mg/kg				
	Result:	Decreased disease activity index (DAI) scores in UC mice.				
Solvent&Solubility	细胞实验:					
	DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (709.28 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)					
	Preparing Stock Solutions	Solvent Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg	
			1 mM	2.8371 mL	14.1856 mL	28.3712 mL
			5 mM	0.5674 mL	2.8371 mL	5.6742 mL
			10 mM	0.2837 mL	1.4186 mL	2.8371 mL
	*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: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (5.90 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (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溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (5.90 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (5.90 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (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]. Jiang F, et al. Discovery of a Potent Grp94 Selective Inhibitor with Anti-Inflammatory Efficacy in a Mouse Model of Ulcerative Colitis. J Med Chem. 2018 Nov 8;61(21):9513-9533.

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 $^{\circ}\text{C}$, 2 years; -20 $^{\circ}\text{C}$, 1 year。-80 $^{\circ}\text{C}$ 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}\text{C}$ 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	2.8371 mL	14.1856 mL	28.3712 mL	70.9280 mL
	5 mM	0.5674 mL	2.8371 mL	5.6742 mL	14.1856 mL
	10 mM	0.2837 mL	1.4186 mL	2.8371 mL	7.0928 mL
	15 mM	0.1891 mL	0.9457 mL	1.8914 mL	4.7285 mL
	20 mM	0.1419 mL	0.7093 mL	1.4186 mL	3.5464 mL
	25 mM	0.1135 mL	0.5674 mL	1.1348 mL	2.8371 mL
	30 mM	0.0946 mL	0.4729 mL	0.9457 mL	2.3643 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: shyysw@sina.com

	40 mM	0.0709 mL	0.3546 mL	0.7093 mL	1.7732 mL
	50 mM	0.0567 mL	0.2837 mL	0.5674 mL	1.4186 mL
	60 mM	0.0473 mL	0.2364 mL	0.4729 mL	1.1821 mL
	80 mM	0.0355 mL	0.1773 mL	0.3546 mL	0.8866 mL
	100 mM	0.0284 mL	0.1419 mL	0.2837 mL	0.7093 mL



源叶