



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: **DMX-5084**
CAS 号: **2306178-56-1**
产品货号: **S87819**

生物活性:

Description	DMX-5804 是一种有效、可口服、选择性的 MAP4K4 抑制剂, 对人 MAP4K4 的 IC ₅₀ 值为 3 nM, pIC ₅₀ 值为 8.55; 对 MINK1/MAP4K6 (pIC ₅₀ , 8.18) 和 TNIK/MAP4K7 (pIC ₅₀ , 7.96) 的作用相对较弱。DMX-5804 能够增强心肌细胞存活率, 减少小鼠的缺血再灌注损伤。				
IC₅₀ & Target 【1】	MAP4K4	MAP4K4	MINK1/MAP4K6	TNIK/MAP4K7	GCK/MAP4K2
	3 nM (IC ₅₀)	8.55 (pIC ₅₀)	8.18 (pIC ₅₀)	7.96 (pIC ₅₀)	6.50 (pIC ₅₀)
	KHS/MAP4K5	GLK/MAP4K3	MLK1/MAP3K9	MLK3/MAP3K11	NUAK
	6.36 (pIC ₅₀)	4.95 (pIC ₅₀)	7.19 (pIC ₅₀)	6.99 (pIC ₅₀)	6.88 (pIC ₅₀)
	VEGFR	ABL1	Aurora B	FLT3	GSK3β
	5.72 (pIC ₅₀)	5.80 (pIC ₅₀)	5.49 (pIC ₅₀)	5.31 (pIC ₅₀)	4.66 (pIC ₅₀)
In Vitro	DMX-5804 对 MAP4K4 表现出比其他激酶更高的选择性, 例如 GCK/MAP4K2 (pIC ₅₀ , 6.50)、GLK/MAP4K3 (pIC ₅₀ , 4.95)、KHS/MAP4K5 (pIC ₅₀ , 6.36)、ABL1 (pIC ₅₀ , 5.80)、Aurora B (pIC ₅₀ , 5.49)、FLT3 (pIC ₅₀ , 5.31)、GSK3 β (pIC ₅₀ , 4.66)、MLK1/MAP3K9 (pIC ₅₀ , 7.19)、MLK3/MAP3K11 (pIC ₅₀ , 6.99), NUAK(pIC ₅₀ , 6.88) 和 VEGFR(pIC ₅₀ , 5.72)[1]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (276.71 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	2.7671 mL	13.8355 mL	27.6709 mL
		5 mM	0.5534 mL	2.7671 mL	5.5342 mL
		10 mM	0.2767 mL	1.3835 mL	2.7671 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 25.0 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Fiedler LR, et al. MAP4K4 Inhibition Promotes Survival of Human Stem Cell-Derived Cardiomyocytes and Reduces Infarct Size In Vivo. Cell Stem Cell. 2019 Mar 1. pii: S1934-5909(19)30013-X.

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	2.7671 mL	13.8355 mL	27.6709 mL	69.1773 mL
	5 mM	0.5534 mL	2.7671 mL	5.5342 mL	13.8355 mL
	10 mM	0.2767 mL	1.3835 mL	2.7671 mL	6.9177 mL
	15 mM	0.1845 mL	0.9224 mL	1.8447 mL	4.6118 mL
	20 mM	0.1384 mL	0.6918 mL	1.3835 mL	3.4589 mL
	25 mM	0.1107 mL	0.5534 mL	1.1068 mL	2.7671 mL
	30 mM	0.0922 mL	0.4612 mL	0.9224 mL	2.3059 mL
	40 mM	0.0692 mL	0.3459 mL	0.6918 mL	1.7294 mL
	50 mM	0.0553 mL	0.2767 mL	0.5534 mL	1.3835 mL
	60 mM	0.0461 mL	0.2306 mL	0.4612 mL	1.1530 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

	80 mM	0.0346 mL	0.1729 mL	0.3459 mL	0.8647 mL
	100 mM	0.0277 mL	0.1384 mL	0.2767 mL	0.6918 mL



源叶