



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

产品名称: **GSK-114**
CAS 号: **1301761-96-5**
产品货号: **S87935**

生物活性:

Description	GSK-114 是一种高选择性的, 具有口服活性的 TNNI3K 抑制剂 (IC50= 25 nM)。GSK-114 对 TNNI3K 的选择性是 B-Raf 激酶的 40 倍 (IC50= 1 μ M)。TNNI3K (又称 CARK) 是酪氨酸样激酶家族的成员, 在心脏组织中选择性表达。				
In Vitro	At a concentration of 1 μ M, GSK114 demonstrated an affinity for seven other kinases: ACK1, B-Raf, GAK, MEK5, PDGFRB, STK36, and ZAK[2].				
In Vivo	GSK-114 affords the best balance of specificity and pharmacokinetics, demonstrating useful oral exposure (poDNAUC=0.18, Cmax=130 ng/ml @ 2 mg/kg, t1/2=3.6 hr, rat Fu=20.2%)[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 5.95 mg/mL (14.25 mM; 超声助溶 (<60°C); 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	2.3953 mL	11.9766 mL	23.9532 mL
		5 mM	0.4791 mL	2.3953 mL	4.7906 mL
		10 mM	0.2395 mL	1.1977 mL	2.3953 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。				
参考文献	[1]. Lawhorn BG, et al. GSK114: A selective inhibitor for elucidating the biological role of TNNI3K. Bioorg Med Chem Lett. 2016;26(14):3355-3358. [2]. Asquith CRM, et al. New Insights into 4-Anilinoquinazolines as Inhibitors of Cardiac Troponin I-Interacting Kinase (TNNi3K). Molecules. 2020;25(7):1697. Published 2020 Apr 7.				

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, 6 months; -20° C, 1 month。-80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.3953 mL	11.9766 mL	23.9532 mL	59.8831 mL
	5 mM	0.4791 mL	2.3953 mL	4.7906 mL	11.9766 mL
	10 mM	0.2395 mL	1.1977 mL	2.3953 mL	5.9883 mL