



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: **PF-6260933**
CAS 号: **1811510-56-1**
产品货号: **S88509**

生物活性:

Description	PF-06260933 是一种具有口服活性的, 高度选择性的 MAP4K4 小分子抑制剂, 在激酶实验和细胞实验中的 IC ₅₀ 值分别为 3.7 和 160 nM。			
IC₅₀ & Target[1]	MAP4K4 3.7 nM (IC ₅₀)			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Epithelial cell	IC ₅₀	> 119 μ M	Cytotoxicity against human liver epithelial cells
	HEK293	IC ₅₀	1.8 μ M	Inhibition of human ERG transfected in HEK293 cells
In Vitro	PF-06260933 对人主动脉内皮细胞 (EC) 的处理在体外 中有力地阻止了 TNF- α 介导的内皮通透性, 类似于 MAP4K4 敲低[2]。			
In Vivo	在小鼠模型中, PF-06260933 处理不会改变血浆脂质含量, 但观察到葡萄糖水平降低, 这与全身可诱导的 Map4k4 基因敲除动物一致。在此动物模型中, PF-06260933 给药可进一步改善斑块形成和/或促进斑块消退 (46.0% 对 25.5%), 并且还观察到血浆葡萄糖和脂质含量降低[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 30 mg/mL (101.10 mM; 超声加热助溶; 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
		1 mM	3.3698 mL	16.8492 mL
		5 mM	0.6740 mL	3.3698 mL
		10 mM	0.3370 mL	1.6849 mL
	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: $\geq$ 2.5 mg/mL (8.42 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 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 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水			



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% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (8.42 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]. Ammirati M, et al. Discovery of an in Vivo Tool to Establish Proof-of-Concept for MAP4K4-Based Antidiabetic Treatment. ACS Med Chem Lett. 2015 Oct 6;6(11):1128-33. [2]. Roth Flach RJ, et al. Endothelial protein kinase MAP4K4 promotes vascular inflammation and atherosclerosis. Nat Commun. 2015 Dec 21;6:8995.

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	3.3698 mL	16.8492 mL	33.6984 mL	84.2460 mL
	5 mM	0.6740 mL	3.3698 mL	6.7397 mL	16.8492 mL
	10 mM	0.3370 mL	1.6849 mL	3.3698 mL	8.4246 mL
	15 mM	0.2247 mL	1.1233 mL	2.2466 mL	5.6164 mL
	20 mM	0.1685 mL	0.8425 mL	1.6849 mL	4.2123 mL
	25 mM	0.1348 mL	0.6740 mL	1.3479 mL	3.3698 mL
	30 mM	0.1123 mL	0.5616 mL	1.1233 mL	2.8082 mL
	40 mM	0.0842 mL	0.4212 mL	0.8425 mL	2.1061 mL
	50 mM	0.0674 mL	0.3370 mL	0.6740 mL	1.6849 mL
	60 mM	0.0562 mL	0.2808 mL	0.5616 mL	1.4041 mL
	80 mM	0.0421 mL	0.2106 mL	0.4212 mL	1.0531 mL
	100 mM	0.0337 mL	0.1685 mL	0.3370 mL	0.8425 mL