



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: **SGC-GAK-1**
CAS 号: **2226517-76-4**
产品货号: **S88600**

生物活性:					
Description	SGC-GAK-1 是一种有效的选择性细胞周期蛋白 G 相关激酶 (GAK) 抑制剂, Ki 为 3.1 nM。 SGC-GAK-1 是 GAK 的化学探针。				
IC50 & Target	Ki: 3.1 nM (GAK)[1]				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	CWR22R	IC ₅₀	0.17 μM	Cytotoxicity against human 22Rv1 cells after 72 hrs by MTS assay	
	HEK293	IC ₅₀	48 nM	Inhibition of tracer 5 binding to human N-terminal nano luciferase-fused GAK expressed in HEK293 cells measured after 2 hrs by nanoBRET assay	
	Huh-7	CC ₅₀	> 10 μM	Cytotoxicity against human Huh-7 cells infected with DENV2 by alamar blue assay	
	LNCaP	IC ₅₀	0.65 μM	Cytotoxicity against human LNCAP cells after 72 hrs by MTS assay	
In Vitro	SGC-GAK-1 有效结合细胞周期蛋白 G 相关激酶 (GAK)、衔接蛋白 2 相关激酶 (AAK1)、丝氨酸/苏氨酸激酶 16 (STK16), Ki 为 3.1 nM, 53 μM, 51 μM[1]。				
	SGC-GAK-1 有效结合细胞周期蛋白 G 相关激酶 (GAK)、受体相互作用蛋白激酶 2 (RIPK2)、AarF 结构域, 其中包含激酶 3 (ADCK3) 和 nemo 样激酶 (NLK), KD 分别为 1.9 nM、110 nM、190 nM 和 520 nM[1]。				
	SGCGAK-1 (0.1、1 和 10 μM, 48 小时或 72 小时) 在 10 μM 时对 LNCaP、VCaP 和 22Rv1 细胞表现出强烈的生长抑制作用, 但对 PC3 和 DU145 细胞的影响极小[1]。				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:	Prostate cancer cells (22Rv1, LNCaP, VCaP, PC3, DU145)			
Concentration:	0.1, 1, and 10 μM				
Incubation Time:	48 hours or 72 hours				
Result:	Showed potent antiproliferative activity in LNCaP and 22Rv1 cells with IC ₅₀ s of 0.05±0.15 μM and 0.17±0.65 μM, respectively.				
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 41.67 mg/mL (107.05 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	2.5691 mL	12.8455 mL	25.6911 mL
		5 mM	0.5138 mL	2.5691 mL	5.1382 mL
10 mM		0.2569 mL	1.2846 mL	2.5691 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: ≥ 2.08 mg/mL (5.34 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 (5.34 mM); 澄清溶液; 超声助溶 此方案可获得 2.08 mg/mL 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 (5.34 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]. Asquith CRM, et al. SGC-GAK-1: A Chemical Probe for Cyclin G Associated Kinase (GAK). J Med Chem. 2019 Feb 26.

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	2.5691 mL	12.8455 mL	25.6911 mL	64.2277 mL
	5 mM	0.5138 mL	2.5691 mL	5.1382 mL	12.8455 mL
	10 mM	0.2569 mL	1.2846 mL	2.5691 mL	6.4228 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

	15 mM	0.1713 mL	0.8564 mL	1.7127 mL	4.2818 mL
	20 mM	0.1285 mL	0.6423 mL	1.2846 mL	3.2114 mL
	25 mM	0.1028 mL	0.5138 mL	1.0276 mL	2.5691 mL
	30 mM	0.0856 mL	0.4282 mL	0.8564 mL	2.1409 mL
	40 mM	0.0642 mL	0.3211 mL	0.6423 mL	1.6057 mL
	50 mM	0.0514 mL	0.2569 mL	0.5138 mL	1.2846 mL
	60 mM	0.0428 mL	0.2141 mL	0.4282 mL	1.0705 mL
	80 mM	0.0321 mL	0.1606 mL	0.3211 mL	0.8028 mL
	100 mM	0.0257 mL	0.1285 mL	0.2569 mL	0.6423 mL



源叶