



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: CPD3508; GSK547

CAS 号: 2226735-55-1

产品货号: S88602

生物活性:

Description	GSK547 (GSK'547) 是一种高效的选择性 receptor-interacting serine/threonine protein kinase 1 (RIPK1) 抑制剂, 可抑制巨噬细胞介导的胰腺癌适应性免疫耐受。				
IC50 & Target	RIPK1				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	L929	IC ₅₀	32 nM	Inhibition of RIP1 in mouse L929 cells assessed as reduction in TNF/zVAD.fmk-induced necrotic death measured after 24 hrs by cell titer-glo luminescent cell viability assay	
In Vitro	GSK547 (0.1-100000 nM; 24 小时) 用不同剂量的重组 TNF α 和 zVAD 预处理 L929 细胞 30 分钟, 然后在 24 小时后以 32 nM 的 IC50 诱导细胞死亡[1]。				
	GSK547 上调骨髓源性巨噬细胞 (BMDM) 中的 STAT1 信号通路[1].				
	Cell Viability Assay[1]				
	Cell Line:		L929 cells (Mouse L-cells NCTC 929)		
	Concentration:		0.1 nM; 10 nM; 1000 nM; 100000 nM		
	Incubation Time:		24 hours		
	Result:		Reduced viability of L929 cells after co-treatment with TNF 伪 and zVAD with an IC ₅₀ of 32 nM.		
	Western Blot Analysis[1]				
	Cell Line:		Bone marrow-derived macrophages (BMDM)		
	Concentration:				
Incubation Time:		30 minutes			
Result:		Up-regulated STAT1 signaling in BMDM.			
In Vivo	GSK547 (GSK'547; RIP1i) 在体内强烈靶向 RIP1。RIP1 抑制导致胰腺癌中的免疫原性巨噬细胞分化, 导致胰腺导管腺癌 (PDA) 的适应性免疫激活和肿瘤保护[1]。				
	GSK547 (100 mg/kg/天; 通过基于食物的剂量喂养; 15-50 天) 与用对照组或 Nec-1s 处理的小鼠相比, 肿瘤负荷减少并延长了生存期[1]。				
	Animal Model:		The wild-type (WT) mice orthotopically implanted with Pdx1Cre;KrasG12D;Trp53R172H (KPC)-derived tumor cells[1]		
	Dosage:		~100 mg/kg		
	Administration:		Fed via food-based dosing, daily, 15-50 days		
	Result:		Reduced tumor burden and extended survival.		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : 175 mg/mL (441.48 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	2.5228 mL	12.6138 mL	25.2277 mL
		5 mM	0.5046 mL	2.5228 mL	5.0455 mL
10 mM		0.2523 mL	1.2614 mL	2.5228 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 (stored under nitrogen)。-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。 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: 5% DMSO → 95% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.31 mM); 澄清溶液 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.25 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.25 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 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 四 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (5.25 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]. Wang W, et al. RIP1 Kinase Drives Macrophage-Mediated Adaptive Immune Tolerance in Pancreatic Cancer. Cancer Cell. 2018 Nov 12;34(5):757-774.e7.
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 (stored under nitrogen)。-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。	



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

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.5228 mL	12.6138 mL	25.2277 mL	63.0692 mL
	5 mM	0.5046 mL	2.5228 mL	5.0455 mL	12.6138 mL
	10 mM	0.2523 mL	1.2614 mL	2.5228 mL	6.3069 mL
	15 mM	0.1682 mL	0.8409 mL	1.6818 mL	4.2046 mL
	20 mM	0.1261 mL	0.6307 mL	1.2614 mL	3.1535 mL
	25 mM	0.1009 mL	0.5046 mL	1.0091 mL	2.5228 mL
	30 mM	0.0841 mL	0.4205 mL	0.8409 mL	2.1023 mL
	40 mM	0.0631 mL	0.3153 mL	0.6307 mL	1.5767 mL
	50 mM	0.0505 mL	0.2523 mL	0.5046 mL	1.2614 mL
	60 mM	0.0420 mL	0.2102 mL	0.4205 mL	1.0512 mL
	80 mM	0.0315 mL	0.1577 mL	0.3153 mL	0.7884 mL
	100 mM	0.0252 mL	0.1261 mL	0.2523 mL	0.6307 mL

源叶