



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: TH-257
CAS 号: 2244678-29-1
产品货号: S88610

生物活性:

Description	TH-257 是一种有效的 LIMK1 和 LIMK2 抑制剂,对 LIMK1 和 LIMK2 的 IC50 值分别为 84 nM 和 39 nM, 是 LIMK1 和 LIMK2 的化学探针。TH-257 是一种变构抑制剂,靶向由 α C 和 DFG-out 构象诱导的结合口袋。TH257 具有极好的选择性,在 1 μ M 浓度下未观察到针对更广泛的激酶组的显着活性。				
IC50 & Target[1]	LIMK1 84 nM (IC50)	LIMK2 39 nM (IC50)			
In Vitro	TH-257 表现出良好的生化和细胞效力。但其极快的体外清除速度使其不适合作为潜在的体内工具[2].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 250 mg/mL (591.66 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)				
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
	Preparing	1 mM	2.3666 mL	11.8332 mL	23.6664 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4733 mL	2.3666 mL	4.7333 mL
		10 mM	0.2367 mL	1.1833 mL	2.3666 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 (4.92 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 μ L 20.8 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 ddH₂ O 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 (4.92 mM); 澄清溶液					



	此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 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 $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (4.92 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08 \text{ mg/mL}$ (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 $100 \text{ }\mu\text{L}$ 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 $900 \text{ }\mu\text{L}$ 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Manetti F. Recent advances in the rational design and development of LIM kinase inhibitors are not enough to enter clinical trials. Eur J Med Chem. 2018 Jul 15;155:445-458. [2]. Collins R, et, al. Comparative Analysis of Small-Molecule LIMK1/2 Inhibitors: Chemical Synthesis, Biochemistry, and Cellular Activity. J Med Chem. 2022 Oct 27;65(20):13705-13713.

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	2.3666 mL	11.8332 mL	23.6664 mL	59.1660 mL
	5 mM	0.4733 mL	2.3666 mL	4.7333 mL	11.8332 mL
	10 mM	0.2367 mL	1.1833 mL	2.3666 mL	5.9166 mL
	15 mM	0.1578 mL	0.7889 mL	1.5778 mL	3.9444 mL
	20 mM	0.1183 mL	0.5917 mL	1.1833 mL	2.9583 mL
	25 mM	0.0947 mL	0.4733 mL	0.9467 mL	2.3666 mL
	30 mM	0.0789 mL	0.3944 mL	0.7889 mL	1.9722 mL
	40 mM	0.0592 mL	0.2958 mL	0.5917 mL	1.4791 mL
	50 mM	0.0473 mL	0.2367 mL	0.4733 mL	1.1833 mL
	60 mM	0.0394 mL	0.1972 mL	0.3944 mL	0.9861 mL
	80 mM	0.0296 mL	0.1479 mL	0.2958 mL	0.7396 mL
	100 mM	0.0237 mL	0.1183 mL	0.2367 mL	0.5917 mL