



生物活性:						
Description	GSK8612 是具有高度选择性的, TBK1 的强效抑制剂, 对重组 TBK1 的 pIC50 值为 6.8。					
IC50 & Target[1]	TBK1 6.8 (pIC ₅₀)					
In Vitro	GSK8612 可抑制 Ramos 细胞中 Toll 样受体 (TLR) 3 诱导的 IRF3 磷酸化和原代人单核细胞中 I 型 IFN 的分泌。在 THP1 细胞中, GSK8612 能够抑制 dsDNA 和 cGAMP (STING 的天然配体) 引起的 IFN β 分泌[1].					
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 125 mg/mL (240.23 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) * " $\geq$ " means soluble, but saturation unknown					
	Solvent Mass Concentration Preparing Stock Solutions	1 mg		5 mg		
		1 mM		19.2186 mL		
		5 mM		3.8437 mL		
		10 mM		1.9219 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 (protect from light)。-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 (4.00 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 ddH ₂ 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 (4.00 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.00 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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。 方案 四 请依序添加每种溶剂: 2% DMSO $\rightarrow$ 40% PEG300 $\rightarrow$ 5% Tween-80 $\rightarrow$ 53% Saline Solubility: $\geq$ 1 mg/mL (1.92 mM); 澄清溶液 方案 五 请依序添加每种溶剂: 2% DMSO $\rightarrow$ 98% Corn Oil Solubility: 1 mg/mL (1.92 mM); 悬浊液; 超声助溶。
参考文献	[1]. Thomson DW, et al. Discovery of GSK8612, a Highly Selective and Potent TBK1 Inhibitor. ACS Med Chem Lett. 2019 Mar 11;10(5):780-785.

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year (protect from light)。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ 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	1.9219 mL	9.6093 mL	19.2186 mL	48.0464 mL
	5 mM	0.3844 mL	1.9219 mL	3.8437 mL	9.6093 mL
	10 mM	0.1922 mL	0.9609 mL	1.9219 mL	4.8046 mL
	15 mM	0.1281 mL	0.6406 mL	1.2812 mL	3.2031 mL
	20 mM	0.0961 mL	0.4805 mL	0.9609 mL	2.4023 mL
	25 mM	0.0769 mL	0.3844 mL	0.7687 mL	1.9219 mL
	30 mM	0.0641 mL	0.3203 mL	0.6406 mL	1.6015 mL
	40 mM	0.0480 mL	0.2402 mL	0.4805 mL	1.2012 mL
	50 mM	0.0384 mL	0.1922 mL	0.3844 mL	0.9609 mL
	60 mM	0.0320 mL	0.1602 mL	0.3203 mL	0.8008 mL
	80 mM	0.0240 mL	0.1201 mL	0.2402 mL	0.6006 mL
	100 mM	0.0192 mL	0.0961 mL	0.1922 mL	0.4805 mL