



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: **GW806742X**

CAS 号: **579515-63-2**

产品货号: **S89143**

生物活性:				
Description	GW806742X 是一种 ATP 模拟物, 是一种有效的 MLKL 抑制剂, 结合 MLKL 假激酶结构域, Kd 值为 9.3 μ M。GW806742X 具有抗 VEGFR2 的活性 (IC ₅₀ =2 nM)。GW806742X 延缓 MLKL 膜移位并抑制坏死。			
IC ₅₀ & Target[1][2]	MLKL 9.3 μ M (Kd)	VEGFR2 2 nM (IC ₅₀)		
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Fibroblast	IC ₅₀	< 50 nM	Anti-necroptotic activity in mouse dermal fibroblast assessed as inhibition in T/S/Q induced necroptosis measured by flow cytometry
	Fibroblast	IC ₅₀	< 50 nM	Anti-neprotic activity in mouse fibroblasts cells
	HUVEC	IC ₅₀	5 nM	Inhibitory concentration against human umbilical vein endothelial cells (HUVECs) induced by VEGF
	Jurkat	EC ₅₀	1.85 μ M	Anti-necroptotic activity in FADD-deficient human Jurkat cells assessed as reduction in cell growth preincubated for 30 mins followed by TNFalpha stimulation incubated overnight by CellTiter-Glo assay
In Vitro	GW806742X (0.1-10000 nM) 以剂量依赖性方式抑制用 TSQ (1 ng/mL TNF、500 nM 化合物 A (Smac 类似物)、10 μ M Q-VD-OPh) 刺激的野生型小鼠真皮成纤维细胞 (MDF) 的坏死性死亡[1]。 GW806742X 显示出对 VEGF 诱导的 HUVEC 增殖的抑制, IC ₅₀ 为 5 nM[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (174.35 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
		1 mM	1.7435 mL	8.7176 mL
		5 mM	0.3487 mL	1.7435 mL
		10 mM	0.1744 mL	0.8718 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 (3.63 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 (3.63 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (3.63 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]. Hildebrand JM, et al. Activation of the pseudokinase MLKL unleashes the four-helix bundle domain to induce membrane localization and necroptotic cell death. Proc Natl Acad Sci U S A. 2014 Oct 21;111(42):15072-7. [2]. Sammond DM, et al. Discovery of a novel and potent series of dianilinopyrimidineurea and urea isostere inhibitors of VEGFR2 tyrosine kinase. Bioorg Med Chem Lett. 2005;15(15):3519-3523.

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	1.7435 mL	8.7176 mL	17.4353 mL	43.5882 mL
	5 mM	0.3487 mL	1.7435 mL	3.4871 mL	8.7176 mL
	10 mM	0.1744 mL	0.8718 mL	1.7435 mL	4.3588 mL
	15 mM	0.1162 mL	0.5812 mL	1.1624 mL	2.9059 mL
	20 mM	0.0872 mL	0.4359 mL	0.8718 mL	2.1794 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

	25 mM	0.0697 mL	0.3487 mL	0.6974 mL	1.7435 mL
	30 mM	0.0581 mL	0.2906 mL	0.5812 mL	1.4529 mL
	40 mM	0.0436 mL	0.2179 mL	0.4359 mL	1.0897 mL
	50 mM	0.0349 mL	0.1744 mL	0.3487 mL	0.8718 mL
	60 mM	0.0291 mL	0.1453 mL	0.2906 mL	0.7265 mL
	80 mM	0.0218 mL	0.1090 mL	0.2179 mL	0.5449 mL
	100 mM	0.0174 mL	0.0872 mL	0.1744 mL	0.4359 mL



源叶