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：shyysw@sina.com

产品名称：PS210
CAS 号： 1221962-86-2
产品货号：S89279

生物活性：

Description	PS210 是一种针对 PDK1 的 PIF 结合口袋的有效且选择性的 PDK1 激活剂。PS210 对其他蛋白激酶 (包括 PDK1 下游信号传导成分，如 S6K，PKB/Akt 或 GSK3) 无活性。在细胞中，PS210 的前药 PS423 可作为 PDK1 的底物选择性抑制剂，抑制 S6K 的磷酸化和活化。
IC50 & Target	Kd: 3 μM (PDK1)[2].
In Vitro	当 PS210 诱导 PDK1 对温度梯度的稳定时，PS210 会稳定位于 aC 螺旋另一端、与 aB 螺旋相对的 Arg131 残基。因此，构成磷酸结合位点的残基似乎是一个固定点，允许 PDK1 激活过程中螺旋的相对移动[1]。

Solvent&Solubility

细胞实验:

DMSO 中的溶解度 ：100 mg/mL (262.94 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	2.6294 mL	13.1472 mL	26.2943 mL
	5 mM	0.5259 mL	2.6294 mL	5.2589 mL
	10 mM	0.2629 mL	1.3147 mL	2.6294 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。-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： 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.57 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 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 ddH_2O 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: ≥ 2.5 mg/mL (6.57 mM); 澄清溶液

此方案可获得 ≥2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD

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：shyysw@sina.com

	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: ≥ 2.5 mg/mL (6.57 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 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 25.0 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]. Busschots K, et al. Substrate-selective inhibition of protein kinase PDK1 by small compounds that bind to the PIF-pocket allosteric docking site. Chem Biol. 2012 Sep 21;19(9):1152-63. [2]. Rettenmaier TJ, et al. A small-molecule mimic of a peptide docking motif inhibits the protein kinase PDK1. Proc Natl Acad Sci U S A. 2014 Dec 30;111(52):18590-5.

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。-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。

可选溶剂	质量 / 溶剂体积 / 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	**1 mM**	2.6294 mL	13.1472 mL	26.2943 mL	65.7358 mL
	5 mM	0.5259 mL	2.6294 mL	5.2589 mL	13.1472 mL
	10 mM	0.2629 mL	1.3147 mL	2.6294 mL	6.5736 mL
	15 mM	0.1753 mL	0.8765 mL	1.7530 mL	4.3824 mL
	20 mM	0.1315 mL	0.6574 mL	1.3147 mL	3.2868 mL
	25 mM	0.1052 mL	0.5259 mL	1.0518 mL	2.6294 mL
	30 mM	0.0876 mL	0.4382 mL	0.8765 mL	2.1912 mL
	40 mM	0.0657 mL	0.3287 mL	0.6574 mL	1.6434 mL
	50 mM	0.0526 mL	0.2629 mL	0.5259 mL	1.3147 mL
	60 mM	0.0438 mL	0.2191 mL	0.4382 mL	1.0956 mL
	80 mM	0.0329 mL	0.1643 mL	0.3287 mL	0.8217 mL
	100 mM	0.0263 mL	0.1315 mL	0.2629 mL	0.6574 mL