



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: **GSK620**
CAS 号: **2088410-46-0**
产品货号: **S89358**

生物活性:

Description	GSK620 是一种化学探针, 是一种有效的口服活性泛 BD2 抑制剂, 具有良好的广谱选择性、可开发性和体内口服药代动力学, 对 BET-BD2 家族蛋白具有高度选择性, 其选择性超过所有其他 BET bromodomains 200 倍以上。GSK620 在人全血中表现出抗炎表型。			
In Vitro	GSK620 在人全血中显示出抗炎表型。人体血液样本用 LPS 刺激, 产生强烈的免疫反应。测量单核细胞趋化蛋白 1 (MCP-1/CCL2)。这是一种趋化因子, 可将单核细胞、记忆 T 细胞和树突状细胞募集到炎症部位。GSK620 以浓度依赖性方式降低 MCP-1 反应, 相对于观察到的生化 BRD4 BD2 效力, (预期)~1 log 效力下降[1]。			
In Vivo	强调 GSK620 作为体内工具的实用性, 在炎症性关节炎、牛皮癣和肝炎的不同模型中观察到疗效[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 33.33 mg/mL (102.44 mM); 超声助溶 (<60°C); 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	3.0735 mL	15.3676 mL
		5 mM	0.6147 mL	3.0735 mL
		10 mM	0.3074 mL	1.5368 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 3.51 mg/mL (10.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.51 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 35.1 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 3.33 mg/mL (10.23 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 3.33 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 33.3 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中, 混合				



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

	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。
参考文献	[1]. Seal JT, et al. The Optimization of a Novel, Weak Bromo and Extra Terminal Domain (BET) Bromodomain Fragment Ligand to a Potent and Selective Second Bromodomain (BD2) Inhibitor. J Med Chem. 2020;63(17):9093-9126.

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	3.0735 mL	15.3676 mL	30.7352 mL	76.8380 mL
	5 mM	0.6147 mL	3.0735 mL	6.1470 mL	15.3676 mL
	10 mM	0.3074 mL	1.5368 mL	3.0735 mL	7.6838 mL
	15 mM	0.2049 mL	1.0245 mL	2.0490 mL	5.1225 mL
	20 mM	0.1537 mL	0.7684 mL	1.5368 mL	3.8419 mL
	25 mM	0.1229 mL	0.6147 mL	1.2294 mL	3.0735 mL
	30 mM	0.1025 mL	0.5123 mL	1.0245 mL	2.5613 mL
	40 mM	0.0768 mL	0.3842 mL	0.7684 mL	1.9209 mL
	50 mM	0.0615 mL	0.3074 mL	0.6147 mL	1.5368 mL
	60 mM	0.0512 mL	0.2561 mL	0.5123 mL	1.2806 mL
	80 mM	0.0384 mL	0.1921 mL	0.3842 mL	0.9605 mL
	100 mM	0.0307 mL	0.1537 mL	0.3074 mL	0.7684 mL