



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **GSK-626616**  
CAS 号: **1025821-33-3**  
产品货号: **T21515**

**生物活性:**

|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                         |                              |           |                                                                                                                  |            |
|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------|-----------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------|
| Description                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                 | GSK-626616 是一种有效的口服生物可利用的 DYRK3 抑制剂, IC50 为 0.7 nM。GSK-626616 以相似的效力抑制 DYRK 家族的其他成员 (例如, DYRK1A 和 DYRK2), GSK-626616 可用于贫血研究。                                                                                                           |                              |           |                                                                                                                  |            |
| IC50 & Target                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                               | DYRK1                                                                                                                                                                                                                                   |                              | DYRK2     | DYRK3                                                                                                            |            |
| Cellular Effect                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | Cell Line                                                                                                                                                                                                                               | Type                         | Value     | Description                                                                                                      |            |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             | HT-22                                                                                                                                                                                                                                   | IC50                         | 27.8 μM   | Cytotoxicity against mouse HT-22 cells assessed as reduction in cell viability incubated for 48 hrs by MTS assay |            |
| In Vitro                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    | GSK-626616 可消除未受刺激的 HeLa 细胞中 S6K1 在苏氨酸 389 位点的磷酸化。GSK-626616 可降低受 EGF 和胰岛素刺激的 HeLa 细胞中 S6K1 在苏氨酸 389 位点的磷酸化, 表明 mTORC1 活性受损[2]。<br>GSK-626616 (血清缺乏的 HeLa 细胞) 可降低 EGF 诱导的 PRAS40 在苏氨酸 246 位点的磷酸化。GSK-626616 可增强 PRAS40 与 mTORC1 的结合[2]。 |                              |           |                                                                                                                  |            |
| Solvent&Solubility                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                          | 细胞实验:<br>DMSO 中的溶解度 : 50 mg/mL (124.60 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                         | 2.4921 mL | 12.4604 mL                                                                                                       | 24.9209 mL |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                         | 5 mM                         | 0.4984 mL | 2.4921 mL                                                                                                        | 4.9842 mL  |
|                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                                             |                                                                                                                                                                                                                                         | 10 mM                        | 0.2492 mL | 1.2460 mL                                                                                                        | 2.4921 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。<br>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。<br>动物实验:<br>请根据您的 实验动物和给药方式 选择适当的溶解方案。<br>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:<br>——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;<br>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<br>方案 一<br>请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline<br>Solubility: ≥ 5 mg/mL (12.46 mM); 澄清溶液<br>此方案可获得 ≥ 5 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。<br>以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 50.0 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。<br>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 |                                                                                                                                                                                                                                         |                              |           |                                                                                                                  |            |



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](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: shyyssw@sina.com

|      |                                                                                                                                                                                                                                                                                                                    |
|------|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
|      | 溶液。                                                                                                                                                                                                                                                                                                                |
| 参考文献 | <p>[1]. Connie L. Erickson-Miller, et al. GSK626616: A DYRK3 Inhibitor as a Potential New Therapy for the Treatment of Anemia. Blood 2007 110:510;</p> <p>[2]. Wippich F, et al. Dual specificity kinase DYRK3 couples stress granule condensation/dissolution to mTORC1 signaling. Cell. 2013;152(4):791-805.</p> |

#### 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<br>溶剂体积<br>浓度 | 1 mg      | 5 mg       | 10 mg      | 25 mg      |
|------|------------------|-----------|------------|------------|------------|
| DMSO | 1 mM             | 2.4921 mL | 12.4604 mL | 24.9209 mL | 62.3022 mL |
|      | 5 mM             | 0.4984 mL | 2.4921 mL  | 4.9842 mL  | 12.4604 mL |
|      | 10 mM            | 0.2492 mL | 1.2460 mL  | 2.4921 mL  | 6.2302 mL  |
|      | 15 mM            | 0.1661 mL | 0.8307 mL  | 1.6614 mL  | 4.1535 mL  |
|      | 20 mM            | 0.1246 mL | 0.6230 mL  | 1.2460 mL  | 3.1151 mL  |
|      | 25 mM            | 0.0997 mL | 0.4984 mL  | 0.9968 mL  | 2.4921 mL  |
|      | 30 mM            | 0.0831 mL | 0.4153 mL  | 0.8307 mL  | 2.0767 mL  |
|      | 40 mM            | 0.0623 mL | 0.3115 mL  | 0.6230 mL  | 1.5576 mL  |
|      | 50 mM            | 0.0498 mL | 0.2492 mL  | 0.4984 mL  | 1.2460 mL  |
|      | 60 mM            | 0.0415 mL | 0.2077 mL  | 0.4153 mL  | 1.0384 mL  |
|      | 80 mM            | 0.0312 mL | 0.1558 mL  | 0.3115 mL  | 0.7788 mL  |
|      | 100 mM           | 0.0249 mL | 0.1246 mL  | 0.2492 mL  | 0.6230 mL  |