

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	N10016
产品名称:	NQDI-1

产品简介:

一种 ASK1 (凋亡信号调节激酶 1) 抑制剂, Ki: 500 nM。NQDI-1 was used to study LPS-induced activation and role of ASK1 and p38 in anti-inflammatory cytokine production by macrophages, NQDI-1 inhibits the activation of caspase-3 and prevents cell death by apoptosis. It is neuroprotective and prevents the ROS-induced apoptosis of the neurons.

靶点:	ASK1	ASK1
	500 nM (Ki)	3 μ M (IC50)

体外研究:

NQDI-1 的选择性在体外对四种丝氨酸/苏氨酸蛋白激酶 (蛋白激酶 CK2 (CK2)、c-Jun N-末端激酶 3 (JNK3)、Rho 相关蛋白激酶 1 (Rock1) 和 Aurora A) 进行评估) 和三种酪氨酸蛋白激酶 (FGFR1、hHGFR 和内皮 TEK 酪氨酸激酶 (Tie2))。结果显示 NQDI-1 是 ASK1 的选择性抑制剂。FGFR1 蛋白激酶的活性被 NQDI-1 抑制 (残留活性为 44%)。NQDI-1 以 500 nM 的 Ki 抑制 ASK1。NQDI-1 对 ASK1 的抑制与磷酸供体底物 ATP 具有竞争性。

体内研究:

脑损伤后脑室内注射 DMSO 中的 250 nmol NQDI-1。Western blotting 检测 ASK1 在假手术组、缺氧缺血 (HI) 组、DMSO 组和 NQDI-1 组中的表达, 表明与 HI 组和 DMSO 组相比, NQDI-1 显著抑制大脑皮层 ASK1 的表达团体。此外, 免疫荧光染色还表明 ASK1 的表达在大脑皮层中被 NQDI-1 抑制。本研究还确定了 ASK1 下游靶标的表达。与 HI 和 DMSO 组相比, NQDI-1 显著降低了 p-JNK、pc-Jun、p53 和 caspase 3 的表达水平。在 NQDI-1 处理组中, 通过免疫荧光也观察到大脑皮层中 p-JNK 的低表达。

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 溶于 DMSO (≥ 5 mg/mL 加热至 60° C)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	3.1318 mL	15.6588 mL	31.3175 mL
5 mM	0.6264 mL	3.1318 mL	6.2635 mL
10 mM	0.3132 mL	1.5659 mL	3.1318 mL
储备液的保存方式: -80° C, 2 years; -20° C, 1 year。			
二: 体内实验			
1、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→45% Saline Solubility: 0.71 mg/mL (2.22 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 0.71 mg/mL 的均匀悬浊液, 悬浊液可用于口服和腹腔注射。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 7.1 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。

2、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE- β -CD in Saline)

Solubility: 0.71 mg/mL (2.22 mM); 悬浊液; 超声助溶

此方案可获得 0.71 mg/mL 的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。

以 1 mL 工作液为例，取 100 μ L 7.1 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 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。

注：工作液建议您现用现配，当天使用。

<1mg/ml 表示微溶或不溶。

普西唐提供的所有化合物浓度为内部测试所得，实际溶液度可能与公布值有所偏差，属于正常的批间细微差异现象。

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。

三、细胞实验

细胞系：MEFs

浓度：10 μ M, 30 μ M 和 50 μ M

处理时间：-

方法：-

四、动物实验

动物模型：Sprague-Dawley 雌性大鼠

剂量：250 nmol

给药处理：侧脑室注射

注意事项：

1、为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。

2、以上信息仅做参考交流之用。

储存：-20 $^{\circ}$ C

