

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	G10599
产品名称:	GSK2837808A

产品简介:

一种有效和选择性的乳酸脱氢酶 A (LDHA) 抑制剂, 对 LDHA 和 LDHB 的 IC ₅₀ 值分别为 1.9 和 14nM。 GSK2837808A is a potent, selective lactate dehydrogenase A (LDHA) inhibitor (IC ₅₀ values are 1.9 and 14 nM for LDHA and LDHB respectively).	
靶点:	IC ₅₀ : 2.6 nM (hLDHA), 43 nM (hLDHB)
体外研究:	
GSK2837808A 可快速显著抑制多种癌细胞系 (包括肝癌细胞和乳腺癌) 中的乳酸生成率。GSK2837808A 对 30 种具有不同 LDHA 和 LDHB 表达水平的癌细胞系的效力范围从 400 nM 到无效 (EC ₅₀ 报告为 30 μM)。GSK2837808A 效力与 LDHA、LDHB 或总 LDH 表达水平无关。GSK2837808A 在缺氧条件下抑制乳酸生成, 但浓度高于常氧条件下的乳酸生成 (EC ₅₀ =10 μM)。它还降低了 ECAR, EC ₅₀ =10 μM。GSK2837808A 对 LDH 的抑制会改变 Snu398 细胞中的多种代谢途径。	
体内研究:	
研究表明, 大鼠静脉输注 0.25 mg/kg GSK2837808A 后的清除率为 69 mL/min/kg, 超过了动物肝脏血流量。大鼠口服 50 mg/kg GSK2837808A 或小鼠口服 100 mg/kg GSK2837808A 后, 血液中化合物浓度等于或低于检测限 2.5 ng/mL。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 溶于 DMSO (≥100mg/mL)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	1.5394 mL	7.6968 mL	15.3936 mL
5 mM	0.3079 mL	1.5394 mL	3.0787 mL
10 mM	0.1539 mL	0.7697 mL	1.5394 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: ≥ 2.5 mg/mL (3.85 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。			
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。

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℃