

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	G70135
产品名称:	GNE-3511

产品简介:

一种生物可利用性和脑渗透 dual leucine zipper kinase (DLK) 抑制剂, 具有口服活性, 其 K_i 值为 0.5 nM。GNE-3511 可穿过血脑屏障, 被用于神经退行性疾病的研究。	
靶点:	K_i : 0.5 nM (DLK); IC50: 30 nM (p-JNK), 107 nM (DRG); >5000 nM (MKK4), >5000 nM (MKK7), 129 nM (JNK1), 514 nM (JNK2), 364 nM (JNK3), 67.8 nM (MLK1), 767 nM (MLK2) and 602 nM (MLK3)
体外研究:	
GNE-3511 has inhibitory activity for p-JNK and DRG with IC50 values of 30 nM and 107 nM, respectively. GNE-3511 has kinase selectivity for MKK4, MKK7, JNK1, JNK2, JNK3, MLK1, MLK2 and MLK3 with IC50 values of >5000 nM, >5000 nM, 129 nM, 514 nM, 364 nM, 67.8 nM, 767 nM and 602 nM, respectively. GNE-3511 displays concentration-dependent protection of neurons from degeneration in vitro.	
体内研究:	
GNE-3511 (oral gavage; 75 mg/kg; single) suppresses CYP-induced nociceptive behavior by inhibiting DLK in mice. GNE-3511 (oral gavage; 75 mg/kg; single) suppresses CYP-induced edema and hemorrhage in mouse bladder. GNE-3511 (iv.; 1 mg/kg or po.; 5 mg/kg) exhibits moderate in vivo plasma clearances, moderate volumes of distribution, short half-lives, and brain penetration.	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 25.63 (Max Conc. mg/mL); 58.18 (Max Conc. mM) Methanol: 1.0 (Max Conc. mg/mL); 2.27 (Max Conc. mM)			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.2702 mL	11.3510 mL	22.7020 mL
5 mM	0.4540 mL	2.2702 mL	4.5404 mL
10 mM	0.2270 mL	1.1351 mL	2.2702 mL
储备液的保存方式: -80°C , 1 year; -20°C , 6 months.			
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: $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (4.72 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq 2.08\text{ mg/mL}$ (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 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：2-8° C 避光 充氮保存

