

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	G70153
产品名称:	GNE-7915

产品简介:

一种高效选择性, 可渗透大脑的 LRRK2 抑制剂, IC50 值为 9 nM。	
靶点:	IC50: 9 nM (LRRK2)
体外研究:	
保持 C-2' /C-5' 处的甲氧基/氟排列和不同的氨基烷基 R1 取代导致 GNE-7915 和化合物 19 的 LRRK2 细胞活性为纳摩尔。在 0.1 μM 下扩展 Invitrogen 激酶分析 (187 种激酶) GNE-7915 (LRRK2 Ki 的 100 倍) 和 19 (LRRK2 Ki 的 250 倍) 均导致仅 TTK 显示出大于 50% 的抑制。使用 DiscoverX KinomeScan55 竞争性结合测定面板 (包括 392 种独特的激酶) 也对 0.1 μM 的 GNE-7915 进行选择分析。对 10 种激酶检测到 >50% 的探针位移结合, 仅对 LRRK2、TTK 和 ALK 检测到 >65%, 进一步支持了 GNE-7915 对 LRRK2 的出色选择性。Cerep 受体分析 (包括扩展的脑组) 表明 GNE-7915 和 19 仅抑制 5-HT2B, 在 10 μM 时抑制 >70%。GNE-7915 和 19 在体外功能试验中被证实是中等强度的 5-HT2B 拮抗剂。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
Chloroform (Slightly), DMSO (Slightly)。			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.2553 mL	11.2765 mL	22.5530 mL
5 mM	0.4511 mL	2.2553 mL	4.5106 mL
10 mM	0.2255 mL	1.1277 mL	2.2553 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 (5.64 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。			
2、请依序添加每种溶剂: 10% DMSO→90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: 2.5 mg/mL (5.64 mM); 悬浊液; 超声助溶 此方案可获得 2.5 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 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 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。			



3、请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→90% Corn Oil

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.64 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, 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 μ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。

4、请依序添加每种溶剂： 5% DMSO→40% PEG300→5% Tween-80→50% Saline

Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.64 mM); 澄清溶液

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。

四、动物实验

动物模型：表达人 LRRK2 蛋白质和 G2019S 帕金森病突变体的 BAC 转基因小鼠

剂量：50 毫克/千克

给药处理：腹腔注射；口服

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℃

