

产品说明书

26 版

基本信息

产品编号:	S14261
产品名称:	西莫司他

产品简介:

一种具有口服活性, 选择性, ATP 竞争性的细胞分裂周期 7 (CDC7) 激酶抑制剂, IC50 为	
靶点:	Cdc7
	<0.3 nM (IC50)
体外研究:	
Simurosertib (TAK-931) 有效抑制 CDC7 激酶活性 (IC50 <0.3 nM), 对其 ATP 结合口袋具有时间依赖性 ATP 竞争动力学。使用 308 种激酶的选择性研究表明, 与其他激酶抑制相比, Simurosertib (TAK-931) 对 CDC7 激酶抑制的选择性超过 120 倍。用 Simurosertib (TAK-931) 处理以剂量依赖性方式抑制 Ser40 (pMCM2) 处的细胞 MCM2 磷酸化, 导致 S 期进展延迟、DNA 损伤检查点激活和 caspase-3/7 激活。	
体内研究:	
在 COLO205 异种移植小鼠模型中, 口服 Simurosertib (TAK-931) 以剂量和时间依赖性方式抑制异种移植 COLO205 的 pMCM2。此外, Simurosertib (TAK-931) 在多种异种移植模型中表现出显著的抗肿瘤活性。	

使用方法 (供参考):

一: 体外实验			
DMSO: 70 mg/mL (205.02 mM; 超声助溶 (<60° C))			
浓度 \ 质量 溶液体积	1mg	5mg	10mg
1 mM	2.9289 mL	14.6443 mL	29.2886 mL
5 mM	0.5858 mL	2.9289 mL	5.8577 mL
10 mM	0.2929 mL	1.4644 mL	2.9289 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: ≥ 2.5 mg/mL (7.32 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 (7.32 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 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 (7.32 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。

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℃

