

产品名称: **GSK2141795**

产品别名: **Uprosertib**

生物活性:						
Description	Uprosertib (GSK2141795) is a potent and selective pan-Akt inhibitor with IC ₅₀ values of 180/328/38 nM for Akt1/Akt2/Akt3, respectively.					
IC ₅₀ & Target	Akt1	Akt2	Akt3	CDK7	ROCK1	ROCK2
	180 nM (IC ₅₀)	328 nM (IC ₅₀)	38 nM (IC ₅₀)	2100 nM (IC ₅₀)	1570 nM (IC ₅₀)	1850 nM (IC ₅₀)
In Vitro	Uprosertib (GSK2141795) inhibits Akt1/2/3 with the K _d values of 16/49/5 nM, respectively. Uprosertib potently inhibits only the PKC family members PRKACA and PRKACB as well as the cGMP-dependent protein kinase PRKG1 apart from the Akts. Protein targets that bind Uprosertib (GSK2141795) in the lysate show a dose-dependent reduction in binding to the kinobeads, while proteins unaffected by the drug show no reduction in binding[1].					
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : ≥ 150 mg/mL (349.45 mM) H ₂ O : < 0.1 mg/mL (insoluble) * "≥" means soluble, but saturation unknown.					
	<div>Preparing Stock Solutions</div>	<div>Solvent / Mass / Concentration</div>	1 mg	5 mg	10 mg	
		1 mM	2.3296 mL	11.6482 mL	23.2964 mL	
		5 mM	0.4659 mL	2.3296 mL	4.6593 mL	
		10 mM	0.2330 mL	1.1648 mL	2.3296 mL	
	<p>*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。</p> <p>储备液的保存方式和期限: -80°C, 6 months; -20°C, 1 month。 -80°C 储存时，请在 6 个月内使用， -20°C 储存时，请在 1 个月内使用。</p> <p>In Vivo:</p> <p>请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂：</p> <p>——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶</p> <div><p>1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline</p><p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM); Clear solution</p><p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。</p><p>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；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。</p></div> <div><p>2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline)</p><p>Solubility: 2.5 mg/mL (5.82 mM); Suspended solution; Need ultrasonic</p><p>此方案可获得 2.5 mg/mL (5.82 mM)的均匀悬浊液，悬浊液可用于口服和腹腔注射。</p><p>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。</p></div>					

	<p>3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL (5.82 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液，此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。</p> <p>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 玉米油中，混合均匀。</p>
References	<p>[1]. Pachl F, et al. Characterization of a chemical affinity probe targeting Akt kinases. J Proteome Res. 2013 Aug 2;12(8):3792-800.</p> <p>[2]. Jacobsen K, et al. Convergent Akt activation drives acquired EGFR inhibitor resistance in lung cancer. Nat Commun. 2017 Sep 4;8(1):410.</p>



源叶生物