



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

产品名称: **GSK 4112**  
产品别名: **SR6452**

### 生物活性:

#### Description

GSK4112 is a Rev-erb $\alpha$  agonist with EC<sub>50</sub> of 0.4  $\mu$ M, also is a small molecule chemical probe for the cell biology of the nuclear heme receptor Rev-erb $\alpha$ . IC<sub>50</sub> value: 0.4  $\mu$ M (EC<sub>50</sub>) Target: Rev-erb $\alpha$  in vitro: GSK4112 profiled as a Rev-erb agonist in cells to inhibit expression of the circadian target gene bmal1. In addition, GSK4112 repressed the expression of gluconeogenic genes in liver cells and reduced glucose output in primary hepatocytes. Therefore, GSK4112 is useful as a chemical tool to probe the function of Rev-erb in transcriptional repression, regulation of circadian biology, and metabolic pathways. Additionally, GSK4112 may serve as a starting point for design of Rev-erb chemical probes with in vivo pharmacological activity.

#### In Vitro:

DMSO : 25 mg/mL (62.99 mM; Need ultrasonic)

H<sub>2</sub>O : < 0.1 mg/mL (insoluble)

	Solvent	Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
Preparing		1 mM	2.5196 mL	12.5979 mL	25.1959 mL
Stock Solutions		5 mM	0.5039 mL	2.5196 mL	5.0392 mL
		10 mM	0.2520 mL	1.2598 mL	2.5196 mL

\*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。

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。

#### In Vivo:

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：

——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

1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline

Solubility:  $\geq$  2.5 mg/mL (6.30 mM); Clear solution

此方案可获得  $\geq$  2.5 mg/mL (6.30 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液。

以 1 mL 工作液为例，取 100  $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400  $\mu$ L PEG300 中，混合均匀向上述体系中加入 50  $\mu$ L Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450  $\mu$ L 生理盐水定容至 1 mL。

2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE- $\beta$ -CD in saline)

Solubility: 2.5 mg/mL (6.30 mM); Suspended solution; Need ultrasonic

此方案可获得 2.5 mg/mL (6.30 mM) 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  $\mu$ L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900  $\mu$ L 20% 的 SBE- $\beta$ -CD 生理盐水水溶液中，混合均匀。



上海源叶生物科技有限公司  
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd  
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248  
网址: [www.shyuanye.com](http://www.shyuanye.com)  
邮箱: [shyysw@sina.com](mailto:shyysw@sina.com)

	<p>3.请依序添加每种溶剂: 10% DMSO →90% corn oil</p> <p>Solubility: <math>\geq 2.5</math> mg/mL (6.30 mM); Clear solution</p> <p>此方案可获得 <math>\geq 2.5</math> mg/mL (6.30 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 <math>\mu</math>L 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 <math>\mu</math>L 玉米油中, 混合均匀。</p>
References	<p>[1]. Grant D, et al. GSK4112, a small molecule chemical probe for the cell biology of the nuclear heme receptor Rev-erba. ACS Chem Biol. 2010 Oct 15;5(10):925-932.</p>



源叶生物