

GSK2334470

产品信息

产品名称	产品编号	规格
GSK2334470	53420ES10	10 mg
	53420ES50	50 mg

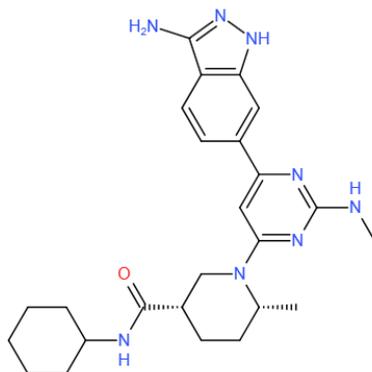
产品描述

GSK2334470 (GSK-2334470)是一种新型的 PDK1 抑制剂, 其 IC₅₀ 值约为 10 nM, 可抑制 PDK1 肽底物的磷酸化。GSK2334470 (1 μM)抑制 Akt Thr308 磷酸化和活性, 并且还抑制 S6K1、SGK1 的活化。GSK2334470 和 PP242 联合治疗可显著抑制肿瘤生长。

产品性质

英文别名 (English Synonym)	GSK-2334470; GSK 2334470
中文名称 (Chinese Name)	PDK1 抑制剂
靶点 (Target)	PDK1
通路 (Pathway)	PI3K/Akt/mTOR--PDK-1
CAS 号 (CAS NO.)	1227911-45-6
分子式 (Formula)	C ₂₅ H ₃₄ N ₈ O
分子量 (Molecular Weight)	462.59
外观 (Appearance)	粉末
纯度 (Purity)	≥98%
溶解性 (Solubility)	溶于 DMSO

结构式 (Structure)



运输和保存方法

冰袋运输。粉末直接保存于-20°C, 有效期 3 年。建议分装后-20°C干燥保存, 避免反复冻融。

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. 粉末溶解前请先短暂离心, 以保证产品全在管底。
3. 请勿吸入、吞咽或者直接接触皮肤和眼睛。
4. 本产品仅用于科研用途, 禁止用于人身上。

使用浓度

【具体使用浓度请参考相关文献，并根据自身实验条件（如实验目的，细胞种类，培养特性等）进行摸索和优化。】

使用方法（数据来自于公开发表的文献，仅供参考）

（一）细胞实验（体外实验）

GSK2334470 (3 μ M, 1 μ M)处理 U87 细胞和成纤维细胞，结果显示在缺乏 PTEN 表达的 U87 胶质母细胞瘤细胞中，GSK2334470 (3 μ M)仅部分抑制 Thr308 磷酸化。GSK2334470 (1 μ M)有效抑制 SGK1 活性。在 MEF（小鼠胚胎成纤维细胞）细胞中，GSK2334470 (1 μ M)抑制 Akt Thr308 磷酸化和活性，并且还抑制 S6K1 以及 SGK1 的活化。^[1]

（二）动物实验（体内实验）

GSK2334470 (40 mg/kg/d, 5 d)、PP242 (20 mg/kg/d, 5 d)、GSK-470 联合 PP242 给药 5 天，腹腔注射，每天一次来处理 MM 异种移植的免疫缺陷小鼠，结果显示与未经治疗的小鼠相比，在多发性骨髓瘤异种移植免疫缺陷小鼠中，GSK2334470 或 PP242 的单独治疗可引起适度的肿瘤体积减少。GSK2334470 和 PP242 联合治疗可显著抑制肿瘤生长。^[2]

参考文献

- [1] Najafov A, et al. Characterization of GSK2334470, a novel and highly specific inhibitor of PDK1. *Biochem. J.* 2011, 433: 357-369.
- [2]. Yang C, et al. PDK1 inhibitor GSK2334470 exerts antitumor activity in multiple myeloma and forms a novel multitargeted combination with dual mTORC1/C2 inhibitor PP242. *Oncotarget.* 2017 Jun 13;8(24):39185-39197.