

BAF312 (Siponimod)

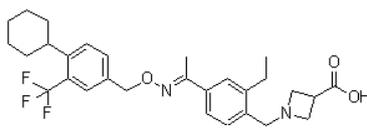
产品编号：MB3825

质量标准：>98%,BR

包装规格：5MG;25MG;100MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C ₂₉ H ₃₅ F ₃ N ₂ O ₃	结 构 式	
分子量	516.60		
CAS No.	1230487-00-9		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO 100 mg/mL warmed (193.57 mM)		
	Ethanol 44 mg/mL warmed (85.17 mM)		
注意事项	溶解性是在室温下测定的，如果温度过低，可能会影响其溶解性。		
其他说明	为了您的安全和健康，请穿实验服并戴一次性手套操作。		

简介:辛波莫德 Siponimod (BAF-312)是有效，选择性的鞘氨醇-1-磷酸 (S1P) 受体调节剂。它对 S1P1 和 S1P5 受体的选择性高于 S1P2，S1P3 和 S1P4。

别名：BAF-312；3-Azetidinecarboxylic acid, 1-[[4-[(1E)-1-[[[4-cyclohexyl-3-(trifluoromethyl)phenyl]methoxy]imino]ethyl]-2-ethylphenyl]methyl]-

物理性状及指标：

外观：.....白色至类白色固体

溶解性：.....DMSO 100 mg/mL warmed (193.57 mM)；Water Insoluble；Ethanol 44 mg/mL warmed (85.17 mM)

含量：.....>98%

储存条件：-20°C，避光防潮密闭干燥

生物活性

产品描述	BAF312 (Siponimod)是一种二代 S1P 受体调节剂，选择性作用于 S1P1 和 S1P5 受体，EC50 分别为 0.39 nM 和 0.98 nM，比作用于 S1P2，S1P3 和 S1P4 受体选择性高 1000 倍以上。Phase 3。	
靶点	S1P1 receptor	S1P5 receptor
	0.39 nM(EC50)	0.98 nM(EC50)
体外研究	BAF312 (Siponimod)是有效的选择性 S1P 受体激动剂，对 S1P ₁ 和 S1P ₅ 受体的 EC50 为 0.39 nM 和 0.98 nM，表现出高于 S1P ₂ 、S1P ₃ 和 S1P ₄ 受体 1000 多倍的选择性。 ^[1] BAF312 (1 μM 下 1 小时)促进 91% S1P1 受体的显著内化。	
体内研究	BAF312 通过内化 S1P ₁ 受体，使其对淋巴结的出口信号不敏感，从而有效抑制大鼠脑脊髓炎 (EAE)。BAF312 以预防或治疗剂量 0.3 毫克/千克在小鼠体内显著降低临床评分。	

美仑相关产品推荐(更多相关靶点抑制剂请详询官网或客服)

MB3755	SKI II
MB3757	JTE-013
MB3756	Ponesimod(ACT-128800)

用途及描述：科研试剂，广泛应用于分子生物学，药理学等科研方面，严禁用于人体。BAF312 (Siponimod)是一种二代 S1P 受体调节剂，选择性作用于 S1P1 和 S1P5 受体，本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 积 浓度	质 量		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.9357 mL	9.6787 mL	19.3573 mL
5 mM	0.3871 mL	1.9357 mL	3.8715 mL
10 mM	0.1936 mL	0.9679 mL	1.9357 mL
50 mM	0.0387 mL	0.1936 mL	0.3871 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验：	<p>GTPγ[35S] 结合测试: 细胞均匀分布，并以 26900 \times g 在 4°C 下离心 30 分钟。细胞膜重悬浮于 20 mM HEPES (pH 7.4), 100 mM NaCl, 10 mM MgCl₂, 1 mM EDTA 和 含 0.1% 脱脂 BSA 的 2-3 毫克蛋白质/毫升溶液中。GTPγ[35S]结合试验，通过细胞膜(75 毫克蛋白质/毫升)在 50 mM HEPES, 100 mM NaCl, 10 mM MgCl₂, 20 微克/毫升皂苷和 0.1%脱脂 BSA (pH 7.4), 5 毫克/毫升小麦胚芽凝集素涂层的闪烁逼近分析珠子，以及 10 μM GDP 中培养进行 10-15 分钟。GTPγ[35S]结合反应通过加入 200 pM GTPγ[35S]启动。在室温下进行 120 分钟后，将板以 300 \times g 离心 10 分钟，并计数。</p>
细胞实验：	<p>Cell lines: CHO Concentrations: ~1 μM Incubation Time: 1 小时 Method: 激动剂介导的 S1P1 受体在 CHO 细胞中的内化作用 通过流式细胞术 Myc 标记的 hS1P1 细胞与激动剂，PBS 清洗后，在标准培养基中于 37°C 下培育 1 小时进行分析。等分试剂在冰上保存 3 小时，另一等分试样在 37°C 下在培养基(不含激动剂)中放置 3 (或 12) 小时。随后细胞与 4 微克/毫升单克隆鼠抗 C-myc IgG1 抗体或同型对照小鼠 IgG1 在 4°C 下培养 60 分钟，随后用 1 微克/毫升 Alexa488 标记的山羊抗小鼠二次结合物培育。细胞通过流式细胞术，每个样品使用 10000 活细胞进行测定。</p>
动物实验：	<p>Animal Models: 脑脊髓炎(EAE)大鼠模型 Formulation: 悬浮在 1%含水的羧甲基纤维素中 Dosages: 0.03, 0.3 和 3 毫克/千克 Administration: 口服灌胃</p>

【注意】

- 我司产品为非无菌包装，若用于细胞培养，请提前做预处理，除去热原细菌，否则会导致染菌。
- 部分产品我司仅提供部分信息，我司不保证所提供信息的权威性，以上数据仅供参考交流研究之用。

活性化合物操作注意事项

1 产品分装：您收到货物后最好不要自己进行分包，因为分包环境、包装材料等因素可能导致分包后的产品变质；如您有特殊包装要求，请在订购时候与我们客服代表阐明，当然价格会做适当调整。对于开盖后，长期未使用的，请务必重新密封好，建议 Parafilm 封口膜，并按照相应储存条件使用。如果放置时间过长，超过产品有效期，建议您重新购买，以免影响实验质量。

2 储备液制备：大部分试剂的溶液形式稳定性较差，请优先采用现用现配的方式。如需制备储存液，请选用合适溶剂，细胞培养类多选择 DMSO，储备液制备完成后请于零下 80 摄氏度储存，一般可以稳定存在 3-6 个月以上。在使用前，再对储备液进行稀释。避免储备液反复冻融。

3 细胞培养工作液制备：请根据个人需要正确计算浓度，稀释储备液或者直接用粉末配置工作液。由于大部分化合物是脂溶性的，所以使用水性溶剂（如 PBS）稀释时，可能会析出沉淀，可通过超声使固体重新溶解，不会对实验产生影响。如用 DMSO 作为溶剂，请确保 DMSO 最终使用浓度 < 0.3%，以避免细胞毒性。灭菌方式，我们建议通过 0.22UM 微膜过滤方式除菌，请勿采用紫外，射线或者高温灭菌方式，否则会影响化合物活性，甚至破坏其结构导致彻底失活。

4 体内动物实验应用：由于很多化合物是脂溶性的，动物实验工作液配制失活，可能会需要加入一些药用辅料作为助溶剂，如吐温，CMC-NA，甘油等，具体需要客户查阅相关文献决定。如使用 DMSO，请确保 DMSO 的终浓度 < 5%，以避免毒性作用。给药剂量设计时候，可以参考下表

动物体表面积等效剂量换算表

物种	体重(KG)	体表面积(M2)	Km 系数
狒狒	12	0.6	20
狗	10	0.5	20
猴	3	0.24	12
兔	1.8	0.15	12
豚鼠	0.4	0.05	8
大鼠	0.15	0.025	6
仓鼠	0.08	0.02	5
小鼠	0.02	0.007	3

动物 A(mg/kg)=动物 B(mg/kg) X 动物 B 的 Km 系数/动物 A 的 Km 系数

5 关于产品到货处理及验收

您收到产品后，请及时查验产品的包装完整性，并对数量进行确认。对于很多微量的产品，数量低于 500MG 的，我们出厂前都是保证正确数量包装的。由于产品包装可能在运输过程中倒置，从而导致产品附着在管壁或者盖子上，这时候请不要先打开盖子，需正位放置轻轻拍打，使产品沉降到管底。对于液体产品，可以在 200 转左右稍作离心，管底收集液体，从而避免损失。

产品标签标示重量会有一定误差，在下面范围内均属于我司正常范围，望周知

标示重量范围	误差范围
1-20MG	0.1MG
50-500MG	1MG
>1G	3-5MG

为什么会看起来包装瓶是空的，如果您购买的产品的量非常小，同时有些产品在冻干的过程中粘附在管壁上形成薄薄的一层，可能观察不到产品的存在。您可以加入指定溶剂（参照操作手册）并涡旋或超声震荡使之完全溶解。

对于蜡状或油状的的产品很难取出称量它们的质量，我们建议您用合适的溶剂直接溶解该化合物；对于具

有吸湿性的化合物，暴露在空气中会吸收水分，呈现液滴状，这种产品需要放置在干燥器中保存。