

R-406 ; R406

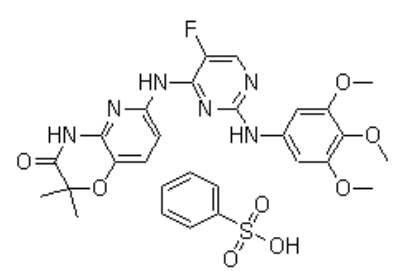
产品编号 : MB3912

质量标准 : >98% , Syk 抑制剂

包装规格 : 5MG;10MG;50MG

产品形式 : solid

基本信息

分子式	C22H23FN6O5.C6H6O3S	结 构 式	
分子量	628.63		
CAS No.	841290-81-1		
储存条件	-20°C , 避光防潮密闭干燥		
溶解性(25°C)	DMSO : 100 mg/mL (159.07 mM) Water Insoluble Ethanol 0 mg/mL (0.0 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 : R406 是一种 ATP 竞争性的 Syk 抑制剂, 有效抑制 Syk 激酶活性。

别名 : 2H-Pyrido[3,2-b]-1,4-oxazin-3(4H)-one, 6-[[[5-fluoro-2-[(3,4,5-trimethoxyphenyl)amino]-4-pyrimidinyl]amino]-2,2-dimethyl-, benzenesulfonate (1:1)

物理性状及指标 :

外观 :浅黄色至卡其色固体

溶解性 :DMSO : 100 mg/mL (159.07 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol 0 mg/mL (0.0 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	R406 是有效的 Syk 抑制剂, IC50 为 41 nM, 强抑制 Syk, 但是不抑制 Lyn, 作用于 Flt3 效果低 5 倍。	
靶点	Flt3(Cell-free assay)	Syk(Cell-free assay) 41 nM
体外研究	R406 强抑制免疫球蛋白 E (IgE) 和 IgG 调节的受体信号活性。R406 抑制 IgE 抗体诱导	

	<p>的 LTC4，细胞因子和趋化因子的产生和释放，包括 TNFα，IL-8，和 GM-CSF。R406 抑制肥大细胞中 T 细胞 Syk 底物连接蛋白的激活和 B 细胞中 B 细胞连接蛋白/SLP65 的磷酸化作用。R406 结合到 Syk 的 ATP 结合袋中，抑制 Syk 的激酶活性，R406 是 ATP 竞争性抑制剂，K_i 为 30 nM。R406 阻断单核细胞/巨噬细胞和中性粒细胞中 Syk 依赖的 FcR 调节活性，且阻断 B 淋巴细胞中 BCR 调节活性。R406 明显诱导慢性淋巴细胞白血病 (CCL) 细胞凋亡，且阻断 CCL3 和 CCL4 分泌。R406 有效抑制血小板信号，且抑制使用特殊抗体或 HIT 病患的血浆通过 FcγRIIA 交叉结合形成的功能。</p>
体内研究	<p>在已经预防处理的鼠内进行阳性 Arthus 反应，5 mg/kg R406 诱导鼠皮肤病变达到 86%。R406 作用于抗体诱导的关节炎鼠模型，也有效抑制炎症。自身免疫反应时，R406 不会影响巨噬细胞和嗜中性粒细胞的功能，免疫毒性为最低水平。</p>
特征	<p>R406 是治疗风湿性关节炎的潜在领先药物。</p>

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)

MB3962	R406 (free base)
MB3963	R788 (Fostamatinib) Disodium
MB5554	Alogliptin(SYK-322) benzoate
MB3964	Fostamatinib (R788)

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。R406 是一种 ATP 竞争性的 Syk 抑制剂，有效抑制 Syk 激酶活性。本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 浓度	质量 积		
	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.5908 mL	7.9538 mL	15.9076 mL
5 mM	0.3182 mL	1.5908 mL	3.1815 mL
10 mM	0.1591 mL	0.7954 mL	1.5908 mL
50 mM	0.0318 mL	0.1591 mL	0.3182 mL

经典实验操作 (仅供参考)

动物实验：	<p>Animal Models: 在 C57BL/6 鼠中腹腔注射 150 μL 取自成年 K/BxN 鼠的混合血清诱导产生关节炎。</p> <p>Formulation: 35% TPGS, 60% PEG 400, 和 5% 丙二醇</p>
--------------	--

	Dosages: 1 或 5 mg/kg Administration: 口服处理
--	--

【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。
- 部分产品我司仅能提供部分信息，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。