

Fostamatinib ; R788

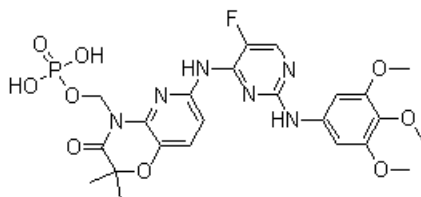
产品编号 : MB3964

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	C23H26FN6O9P	结 构 式	
分子量	580.46		
CAS No.	901119-35-5		
储存条件	-20℃，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25℃)	DMSO : 116 mg/mL (199.84 mM) Water Insoluble Ethanol Insoluble		
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 : 福他替尼 R788 (Fostamatinib)是 R406 的活性代谢物的原药, 是 Syk 抑制剂。**别名 :** R788 ; R-788;

(6-(5-fluoro-2-(3,4,5-trimethoxyphenylamino)pyrimidin-4-ylamino)-2,2-dimethyl-3-oxo-2,3-dihydropyrido[3,2-b][1,4]oxazin-4-yl)methyl dihydrogen phosphate

物理性状及指标 :

外观 :白色至类白色固体

溶解性 :DMSO : 116 mg/mL (199.84 mM) ; Water Insoluble ; Ethanol Insoluble

含量 :>98%

储存条件 : -20℃ , 避光防潮密闭干燥**生物活性**

产品描述	R788 (Fostamatinib)是活性代谢产物 R406 的前体药物, 是 Syk 抑制剂, IC50 为 41 nM, 强抑制 Syk 但不抑制 Lyn,对 Flt3 作用效果低 5 倍。			
靶点	Syk	Adenosine A3 receptor	Adenosine transporter	Monoamine transporter

IC50	41 nM	81 nM	1.84 μ M	2.74 μ M
体外研究	R788 是脾酪氨酸激酶(Syk)抑制剂 R406 的前药。R788 是一种 ATP 结合的竞争性抑制, K_i 为 30 nM。R788 剂量依赖性抑制抗- IgE 介导的 CHMC 脱粒, EC50 为 56 nM。R788 也会抑制抗-IgE 诱导的 LTC4, 细胞因子以及趋化因子, 包括 TNF α , IL-8, 和 GM-CSF 的产生与释放。R788 对 Syk 的抑制导致 Syk 信号下游所有磷酸化作用被抑制。CHMC 中在 Fc ϵ RI 信号之后, R788 主要抑制 IL-4 和 IL-2 受体信号。在人肥大细胞, 巨噬细胞, 和中性粒细胞中, R788 特异性抑制 Fc γ R 信号。R788 能够抑制免疫复合物介导的局部炎症损伤。R788 诱导大部分受检 DLBCL 细胞系的凋亡。在 R788 敏感性 DLBCL 细胞系, R788 特异性抑制刺激和配体诱导的 BCR 信号(SYK525/526 自身磷酸化和 SYK 依赖性 B 细胞连接蛋白[BLNK]磷酸化)。			
体内研究	在逆转-被动阿瑟斯反应和双抗体诱导的关节炎模型中, R788 对小鼠口服给药减少免疫复合物介导的炎症。在另一项研究中, R788 有效抑制体内 BCR 信号, 导致恶性 B 细胞的增殖和存活减少, 并显著延长治疗组动物的存活。在风湿性关节炎模型中, R788 显著减少主要炎症介质, 比如 TNF α , IL-1, IL-6 和 IL-18, 从而减少炎症和骨退化。			
特征	在体内转化为其活性代谢物 R406。			

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)

MB3912	R406
MB3962	R406 (free base)
MB3963	R788 (Fostamatinib) Disodium

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。R788 (Fostamatinib)是活性代谢产物 R406 的前体药物, 是 Syk 抑制剂, 本品可用于相关领域的科研实验。

储液配置

体 质 浓度 量 积	1 mg	5 mg	10 mg
1 mM	1.7228 mL	8.6139 mL	17.2277 mL
5 mM	0.3446 mL	1.7228 mL	3.4455 mL
10 mM	0.1723 mL	0.8614 mL	1.7228 mL
50 mM	0.0345 mL	0.1723 mL	0.3446 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	荧光偏振激酶试验和 K_i 测定: 进行荧光偏振反应。对于 K_i 测定, 200- μ L 的反应重复两份以 8 个不同 ATP 浓度(从 200 μ M 开始, 2 倍连续稀释), 在 DMSO 或 125, 62.5, 31.25, 15.5, 或 7.8 nM 浓度的 R788 存在下建立。在不同时间点, 移除每个反应的 20 μ L 反应混合物, 并淬灭停止反应。对于每个浓度的 R788, 测定每个浓度下的 ATP 反应速率, 并对 ATP 浓度作图, 以测定表观 K_m 和 V_{max} (最大速率)。最终, 表观 K_m (或表观 K_i/V_{max})对抑制剂浓度作图, 以测定 K_i 。
细胞实验	Cell lines: 培养的人肥大细胞(CHMC) Concentrations: 0 μ M -100 μ M Incubation Time: 30 分钟 Method: 培养的人肥大细胞(CHMC)衍生自脐带血 CD34 ⁺ 祖细胞, 并在增补的培养液中生长, 待发, 并刺激。在刺激前, 细胞用 R788 或 DMSO 培养 30 分钟。然后细胞用 0.25 到 2 mg/mL 抗-IgE 或抗-IgG 或 2 μ M 离子霉素刺激。对于类胰蛋白酶测定, 细胞以~1500/孔在改良的 Tyrode 缓冲液中刺激 30 分钟。对于 LTC4 和细胞因子的产生, 以 100,000 细胞/孔分别刺激 1 小时或 7 小时。类胰蛋白酶活性通过多肽底物的荧光读出, LTC4 和细胞因子使用 Luminex 多重技术测量。
动物实验	Animal Models: 患有关节炎的 Balb/c 小鼠 Formulation: 35% TPGS, 60% PEG 400, 5% 丙二醇 Dosages: 1 mg/kg 或 5 mg/kg Administration: 口服, 每日两次

【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。

