

PRT062607 (P505-15, BIIB057) HCl

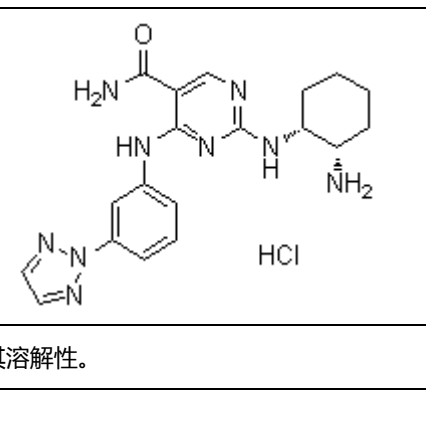
产品编号：MB5499

质量标准：>98%，Syk 抑制剂

包装规格：10MG;50MG;250MG

产品形式：solid

基本信息

分子式	C19H23N9O.HCl	结 构 式	
分子量	429.91		
CAS No.	1370261-97-4		
储存条件	-20°C，避光防潮密闭干燥		
溶解性 (25°C)	DMSO : 86 mg/mL (200.04 mM) Water : 86 mg/mL (200.04 mM) 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：PRT062607 hydrochloride 是一种有效的纯化的 Syk 抑制剂。

别名：P505-15 Hydrochloride ; 5-Pyrimidinecarboxamide, 2-[[[(1R,2S)-2-aminocyclohexyl]amino]-4-[[3-(2H-1,2,3-triazol-2-yl)phenyl]amino]-, hydrochloride (1:1)

物理性状及指标：

外观：.....淡黄色至卡其色固体

溶解性：.....DMSO : 86 mg/mL (200.04 mM) ; Water : 86 mg/mL (200.04 mM) ; Ethanol Insoluble

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	PRT062607 (P505-15, BIIB057) HCl 是一种新型的，高度选择性 Syk 抑制剂，无细胞试验中 IC50 为 1 nM，作用于 Syk 比作用于 Fgr, Lyn, FAK, Pyk2 和 Zap70 选择性高 80 倍以上。		
靶点	Syk (Cell-free assay)	FGR (Cell-free assay)	MLK1 (Cell-free assay)

	1 nM	81 nM	88 nM
体外研究	PRT062607(P505-15)具有抗 SYK 活性，比作用于其它激酶的亲和力至少高 80 倍。PRT062607 有效抑制 B 细胞抗原受体介导的 B 细胞信号和激活 (IC ₅₀ 分别为 0.27 和 0.28 μM)，且有效抑制 Fcε 受体 1 介导的嗜碱性细胞脱粒 (IC ₅₀ 为 0.15 μM)。PRT062607 作用于 CLL 细胞，抑制 BCR 依赖性的趋化因子 CCL3 和 CCL4 分泌，且抑制白血病细胞向组织归巢趋化因子 CXCL12, CXCL13, 和间质细胞下方迁移。触发 BCR 后，PRT062607 进一步抑制 Syk 和细胞外信号调节激酶的磷酸化。		
体内研究	药代动力学/药效学关系显示，按 30 mg/kg 剂量处理小鼠 24 小时期间，Syk 抑制维持在 70%。按 15 mg/kg 剂量处理 24 小时，抑制 Syk 范围为 7.5% (C _{min}) 到 78.4% (C _{max}) 平均抑制 67%。PRT062607 口服处理两种啮齿动物的类风湿关节炎模型，产生抗炎活性，这种作用存在剂量依赖性。在特异性抑制 67% Syk 活性的浓度时，可观察到统计学显著疗效。		

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)

MB3964	Fostamatinib (R788)
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。本品是一种有效的纯化的 Syk 抑制剂，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	2.3261 mL	11.6303 mL	23.2607 mL
5 mM	0.4652 mL	2.3261 mL	4.6521 mL
10 mM	0.2326 mL	1.1630 mL	2.3261 mL
50 mM	0.0465 mL	0.2326 mL	0.4652 mL

经典实验操作 (仅供参考)

激酶实验	荧光共振能量转移 (FRET) 分析: 在各种浓度 PRT062607 存在时，测量 Syk 引起的底物磷酸化的程度。通过特异性作用于磷酸化酪氨酸的荧光抗体，使用 FRET 的增加，测定 Syk 活性，检测十二种浓度用于剂量反应。通过测评 PRT062607 在 270 个独立的纯化激酶检测中的效果，而测定激酶抑制的特异性和效力。PRT062607 按一式两份实验用于分析。随后，使用进行放射性检测，测定 IC ₅₀ ，优化
-------------	---

	ATP 浓度，用于测定每个单独的激酶。进行所有放射性 ATP 摄入酶实验。
细胞实验	Cell lines: Syk 依赖性的 BaF3 细胞 Concentrations: ~6 μ M Incubation Time: 3 天 Method: CellTiter Glo
动物实验	Animal Models: 小鼠胶原蛋白抗体诱导性关节炎模型 Formulation: -- Dosages: 5, 15, 30 mg/kg, 每天两次 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，否则会严重影响化合物活性，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
狻狻	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。