

产品名称：**Selonsertib**
产品别名：**Selonsertib**

生物活性：				
Description	Selonsertib, an orally bioavailable, selective apoptosis signal-regulating kinase 1 (ASK1) inhibitor with a pIC ₅₀ of 8.3, has been evaluated as an experimental treatment for diabetic nephropathy and kidney fibrosis.			
IC ₅₀ & Target	ASK1			
	8.3 (pIC ₅₀)			
In Vitro	Selonsertib (GS-4997) is a clinical stage ASK1 inhibitor, which has been evaluated as an experimental treatment for diabetic nephropathy and kidney fibrosis[1]. Selonsertib (GS-4997) is a highly selective and potent once-daily oral ASK1 inhibitor that competes with ATP in the ASK1 catalytic kinase domain[2].			
Solvent&Solubility	In Vitro: DMSO : 31 mg/mL (69.59 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown.			
		Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.2447 mL	11.2236 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4489 mL	2.2447 mL
		10 mM	0.2245 mL	1.1224 mL
	*请根据产品在不同溶剂中的溶解度选择合适的溶剂配制储备液；一旦配成溶液，请分装保存，避免反复冻融造成的产品失效。 储备液的保存方式和期限：-80℃，6 months；-20℃，1 month。-80℃ 储存时，请在 6 个月内使用，-20℃ 储存时，请在 1 个月内使用。 In Vivo: 请根据您的实验动物和给药方式选择适当的溶解方案。以下溶解方案都请先按照 In Vitro 方式配制澄清的储备液，再依次添加助溶剂： ——为保证实验结果的可靠性，澄清的储备液可以根据储存条件，适当保存；体内实验的工作液，建议您现用现配，当天使用； 以下溶剂前显示的百分比是指该溶剂在您配制终溶液中的体积占比；如在配制过程中出现沉淀、析出现象，可以通过加热和/或超声的方式助溶			
	1.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→40% PEG300 →5% Tween-80 → 45% saline Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后继续加入 450 μL 生理盐水定容至 1 mL。			
	2.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO→ 90% (20% SBE-β-CD in saline) Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM，饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水溶液中，混合均匀。			
	3.请依序添加每种溶剂： 10% DMSO →90% corn oil			

	Solubility: ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM); Clear solution 此方案可获得 ≥ 2.08 mg/mL (4.67 mM, 饱和度未知) 的澄清溶液, 此方案不适用于实验周期在半个月以上的实验。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中, 混合均匀。
References	[1]. Lanier M, et al. Structure-Based Design of ASK1 Inhibitors as Potential Agents for Heart Failure. <u>ACS Med Chem Lett.</u> 2017 Feb 8;8(3):316-320. [2]. Lin JH, et al. Design of a phase 2 clinical trial of an ASK1 inhibitor, GS-4997, in patients with diabetic kidney disease. <u>Nephron.</u> 2015;129(1):29-33. [3]. Loomba R, et al. The ASK1 inhibitor selonsertib in patients with nonalcoholic steatohepatitis: A randomized, phase 2 trial. <u>Hepatology.</u> 2018 Feb;67(2):549-559.



源叶生物