



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

产品名称: **Vercirnon**
CAS 号: **698394-73-9**
产品货号: **S86254**

生物活性:

Description	Vercirnon (GSK-1605786) 是一种具有口服活性的，选择性的 CCR9 拮抗剂。Vercirnon 抑制 CCR9 介导的 Molt-4 细胞上 Ca2+ 移动和趋化性，IC50 值分别为 5.4 和 3.4 nM。Vercirnon 对 CCR9 的选择性高于 CCR1-12 和 CX3CR1-7 (IC50s=>10 μM)。Vercirnon 是 CCR9 的两种剪接形式 (CCR9A 和 CCR9B) 的 CCL25 定向趋化性的等效抑制剂，IC50 值分别为 2.8 和 2.6 nM[1]。				
IC50 & Target[3]	CCR9 10 nM (IC50)				
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description	
	BaF3	IC50	2.6 nM	Antagonist activity at recombinant human CCR9B expressed in BAF3 cells assessed as reduction in CCL25-induced chemotaxis preincubated for 10 mins followed by addition of CCL25 and measured after 120 min by QUANT dye based fluorescence assay	
	BaF3	IC50	2.8 nM	Antagonist activity at recombinant human CCR9A expressed in BAF3 cells assessed as reduction in CCL25-induced chemotaxis preincubated for 10 mins followed by addition of CCL25 and measured after 120 min by QUANT dye based fluorescence assay	
In Vitro	Vercirnon (GSK-1605786) 抑制原代 CCR9 表达细胞对 CCL25 的趋化作用，IC50 为 6.8 nM。Vercirnon 抑制 CCL25 诱导的视黄酸 (RA) 培养的人类 T 细胞的趋化作用。Vercirnon 抑制 100% 人类 AB 血清中 RA 培养细胞 CCL25 介导的趋化作用，IC50 为 141 nM。Vercirnon 是 CCL25 诱导的小鼠和大鼠胸腺细胞趋化作用的强效抑制剂，IC50 值分别为 6.9 nM 和 1.3 nM[1]。				
In Vivo	Vercirnon (GSK-1605786) (10、50 mg/kg；皮下注射；每天两次；从 2 周龄开始直至 12 周龄) 可改善 TNF Δ ARE 小鼠模型中肠道炎症的严重程度[1]。				
	Animal Model:		C57BL/6 mice (TNFΔARE Mouse Model of Terminal Ileitis)[1]		
	Dosage:		10, 50 mg/kg		
	Administration:		Subcutaneous; twice per day; starting at 2 weeks of age until 12 weeks of age		
	Result:		Resulted in complete protection from the severe inflammation associated with TNF- overexpression at 50 mg/kg. A similar protective effect was also noted with a lower dose		
Solvent&Solubility	细胞实验:				
	DMSO 中的溶解度 : ≥ 25 mg/mL (56.19 mM; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响，请使用新开封的 DMSO)				
	* "≥" means soluble, but saturation unknown				
		Solvent Concentration	Mass	1 mg	5 mg
	Preparing	1 mM	2.2475 mL	11.2377 mL	22.4754 mL
	Stock Solutions	5 mM	0.4495 mL	2.2475 mL	4.4951 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

		10 mM	0.2248 mL	1.1238 mL	2.2475 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。 动物实验： 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 方案 一 请依序添加每种溶剂： 10% DMSO → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.62 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度未知）的澄清溶液，此方案实验周期在半个月以上的动物实验酌情使用。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μL 玉米油中，混合均匀。				
参考文献	[1]. Walters MJ, et al. Characterization of CCX282-B, an orally bioavailable antagonist of the CCR9 chemokine receptor, for treatment of inflammatory bowel disease. J Pharmacol Exp Ther. 2010 Oct;335(1):61-9. [2]. Bekker P, et al. CCR9 Antagonists in the Treatment of Ulcerative Colitis. Mediators Inflamm. 2015;2015:628340. [3]. Zhang J, et al. Biarylsulfonamide CCR9 inhibitors for inflammatory bowel disease. Bioorg Med Chem Lett. 2015 Sep 1;25(17):3661-4.				
完整储备液配制表： 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℃, 2 years; -20℃, 1 year。-80℃ 储存时，请在 2 年内使用， -20℃ 储存时，请在 1 年内使用。					
可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2475 mL	11.2377 mL	22.4754 mL	56.1886 mL
	5 mM	0.4495 mL	2.2475 mL	4.4951 mL	11.2377 mL
	10 mM	0.2248 mL	1.1238 mL	2.2475 mL	5.6189 mL
	15 mM	0.1498 mL	0.7492 mL	1.4984 mL	3.7459 mL
	20 mM	0.1124 mL	0.5619 mL	1.1238 mL	2.8094 mL
	25 mM	0.0899 mL	0.4495 mL	0.8990 mL	2.2475 mL



上海源叶生物科技有限公司
Shanghai yuanye Bio-Technology Co., Ltd
电话: 021-61312973 传真: 021-55068248
网址: www.shyuanye.com
邮箱: shyyssw@sina.com

	30 mM	0.0749 mL	0.3746 mL	0.7492 mL	1.8730 mL
	40 mM	0.0562 mL	0.2809 mL	0.5619 mL	1.4047 mL
	50 mM	0.0450 mL	0.2248 mL	0.4495 mL	1.1238 mL



源叶