



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: VTX-27
CAS 号: 1321924-70-2
产品货号: S87703

生物活性:				
Description	VTX-27 是蛋白激酶 C θ (PKC θ) 的选择性抑制剂, 其对 PKC θ 和 PKC δ 的 K_i 值分别为 0.08 nM 和 16 nM。			
IC50 & Target[1]	PKC θ 0.08 nM (Ki)	PKC δ 16 nM (Ki)	PKC α 356 nM (Ki)	
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	PBMC	IC ₅₀	11 nM	Inhibition of PKC-theta in human PBMC cells assessed as inhibition of IL-2 after 24 hrs by bead-based FLISA assay
In Vitro	VTX-27 (化合物 27) 具有卓越的整体特性。此外, VTX-27 对其他蛋白激酶 C (PKC) 家族成员也表现出很好的选择性, 尤其是对于经典亚型 (除了 PKC β 1 为 200 倍外, 其余均超过 1000 倍) 和非典型亚型 (超过 10000 倍)。正如预期的那样, 相对于更为密切相关的新型 PKC 家族成员获得选择性更具挑战性, 但 VTX-27 对 PKC δ 仍实现了约 200 倍的良好选择性[1]。			
In Vivo	VTX-27 显示出最佳的药代动力学 (PK) 特性, 其特征包括低清除率 (7 mL $\cdot$ min ⁻¹ $\cdot$ kg ⁻¹)、较长的半衰期 (4.7 小时) 以及良好的口服生物利用度 (65%)。当以单次口服方式给予 VTX-27 时, 剂量分别为 6.25 mg/kg、12.5 mg/kg、25 mg/kg 和 50 mg/kg (例如, 在 25 mg/kg 剂量下 C _{max} 浓度达到 700 ng/mL), 该药物表现出强烈的剂量依赖性抑制白细胞介素-2 (IL-2) 产生的效果[1]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 125 mg/mL (298.40 mM); 超声助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass / Concentration	1 mg	5 mg
		1 mM	2.3872 mL	11.9360 mL
		5 mM	0.4774 mL	2.3872 mL
		10 mM	0.2387 mL	1.1936 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°C, 2 years; -20°C, 1 year。-80°C 储存时, 请在 2 年内使用, -20°C 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.97 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μ L PEG300 中, 混			



	合均匀; 再向上述体系中加入 50 μ L Tween-80, 混合均匀; 然后再继续加入 450 μ L 生理盐水 定容至 1 mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。 方案 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.97 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 20% 的 SBE-β-CD 生理盐水水溶液 中, 混合均匀。 2 g SBE-β-CD (磺丁基醚 β-环糊精) 粉末定容于 10 mL 的生理盐水中, 完全溶解至澄清透明。 方案 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.08 mg/mL (4.97 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 2.08 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 μ L 20.8 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 900 μ L 玉米油中, 混合均匀。
参考文献	[1]. Jimenez JM, et al. Design and optimization of selective protein kinase C θ (PKC θ) inhibitors for the treatment of autoimmune diseases. J Med Chem. 2013 Mar 14;56(5):1799-810.

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 $^{\circ}$ C, 2 years; -20 $^{\circ}$ C, 1 year。-80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 2 年内使用, -20 $^{\circ}$ C 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	2.3872 mL	11.9360 mL	23.8720 mL	59.6801 mL
	5 mM	0.4774 mL	2.3872 mL	4.7744 mL	11.9360 mL
	10 mM	0.2387 mL	1.1936 mL	2.3872 mL	5.9680 mL
	15 mM	0.1591 mL	0.7957 mL	1.5915 mL	3.9787 mL
	20 mM	0.1194 mL	0.5968 mL	1.1936 mL	2.9840 mL
	25 mM	0.0955 mL	0.4774 mL	0.9549 mL	2.3872 mL
	30 mM	0.0796 mL	0.3979 mL	0.7957 mL	1.9893 mL
	40 mM	0.0597 mL	0.2984 mL	0.5968 mL	1.4920 mL
	50 mM	0.0477 mL	0.2387 mL	0.4774 mL	1.1936 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: shyyw@sina.com

	60 mM	0.0398 mL	0.1989 mL	0.3979 mL	0.9947 mL
	80 mM	0.0298 mL	0.1492 mL	0.2984 mL	0.7460 mL
	100 mM	0.0239 mL	0.1194 mL	0.2387 mL	0.5968 mL



源叶