



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: **SAR-20347**
CAS 号: **1450881-55-6**
产品货号: **S87931**

生物活性:

Description	SAR-20347 是 TYK2, JAK1, JAK2 和 JAK3 的抑制剂, 其 IC ₅₀ 值分别为 0.6, 23, 26 和 41 nM。			
IC₅₀ & Target[1]	Tyk2 0.6 nM (IC ₅₀)	JAK1 23 nM (IC ₅₀)	JAK2 26 nM (IC ₅₀)	JAK3 41 nM (IC ₅₀)
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	Jurkat	IC ₅₀	0.6 nM	Inhibition of TYK2 in human Jurkat cells assessed as reduction in IFN-alpha stimulated TYK2 phosphorylation by caspase3/7 reagent-based Western blot analysis
	Jurkat	IC ₅₀	23 nM	Inhibition of JAK1 in human Jurkat cells assessed as reduction in IFN-alpha stimulated JAK1 phosphorylation by caspase3/7 reagent-based Western blot analysis
	Jurkat	IC ₅₀	26 nM	Inhibition of JAK2 in human Jurkat cells assessed as reduction in IFN-alpha stimulated JAK2 phosphorylation by caspase3/7 reagent-based Western blot analysis
	Jurkat	IC ₅₀	41 nM	Inhibition of JAK3 in human Jurkat cells assessed as reduction in IFN-alpha stimulated JAK3 phosphorylation by caspase3/7 reagent-based Western blot analysis
In Vitro	当用 IL-12 刺激 NK-92 细胞时, SAR-20347 有效抑制 IL-12 介导的 STAT4 磷酸化, 这是一种 TYK2 依赖性事件, IC ₅₀ 为 126 nM。SAR-20347 表现出 TYK2 > JAK1 > JAK2 > JAK3 的选择性。培养基中不含 IL-12 的细胞没有可测量的 IFN- γ , 而与 IL-12 和 SAR-20347 一起孵育的细胞表现出对 IFN- γ 产生的剂量依赖性抑制。SAR-20347 以剂量依赖性方式抑制分泌性胚胎碱性磷酸酶 (SEAP) 的产生, 在这些实验中, 5 μ M SAR-20347 的抑制作用最强[1]。			
In Vivo	与载体处理的动物相比, 60 mg/kg SAR-20347 抑制血清中 IFN- γ 的产生 91%, 表明 SAR-20347 可以体内抑制 TYK2 信号转导。根据平均信号强度测量, SAR-20347 处理显著降低了 IL-17 的产生, 这与基因表达分析[1]一致。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (224.80 mM); 超声加热助溶; 吸湿的 DMSO 对产品的溶解度有显著影响, 请使用新开封的 DMSO) H ₂ O 中的溶解度 : < 0.1 mg/mL (insoluble)			
	Preparing Stock Solutions	Solvent	Mass	
		Concentration		
		1 mM	2.2480 mL	11.2400 mL
		5 mM	0.4496 mL	2.2480 mL
		10 mM	0.2248 mL	1.1240 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: ≥ 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。 以 1 mL 工作液为例，取 100 μL 25.0 mg/mL 的澄清 DMSO 储备液加到 400 μL PEG300 中，混合均匀；再向上述体系中加入 50 μL Tween-80，混合均匀；然后再继续加入 450 μL 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 ddH₂O 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) 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。 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 20% 的 SBE-β-CD 生理盐盐水溶液 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。
参考文献	[1]. Works MG, et al. Inhibition of TYK2 and JAK1 ameliorates imiquimod-induced psoriasis-like dermatitis by inhibiting IL-22 and the IL-23/IL-17 axis. J Immunol. 2014 Oct 1;193(7):3278-87.

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° 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。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	2.2480 mL	11.2400 mL	22.4800 mL	56.2000 mL
	5 mM	0.4496 mL	2.2480 mL	4.4960 mL	11.2400 mL
	10 mM	0.2248 mL	1.1240 mL	2.2480 mL	5.6200 mL
	15 mM	0.1499 mL	0.7493 mL	1.4987 mL	3.7467 mL
	20 mM	0.1124 mL	0.5620 mL	1.1240 mL	2.8100 mL
	25 mM	0.0899 mL	0.4496 mL	0.8992 mL	2.2480 mL
	30 mM	0.0749 mL	0.3747 mL	0.7493 mL	1.8733 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

	40 mM	0.0562 mL	0.2810 mL	0.5620 mL	1.4050 mL
	50 mM	0.0450 mL	0.2248 mL	0.4496 mL	1.1240 mL
	60 mM	0.0375 mL	0.1873 mL	0.3747 mL	0.9367 mL
	80 mM	0.0281 mL	0.1405 mL	0.2810 mL	0.7025 mL
	100 mM	0.0225 mL	0.1124 mL	0.2248 mL	0.5620 mL



源叶