



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: **Ralinepag**
CAS 号: **1187856-49-0**
产品货号: **S88286**

生物活性:

Description	Ralinepag 是一种有效的，可口服的，非前列腺素类 prostacyclin (IP) receptor 激动剂，对人和大鼠的 IP 受体的 EC50 值分别为 8.5 nM 和 530 nM，对人 DP1 受体的 EC50 值为 850 nM。				
IC50 & Target[1]	hIP 8.5 nM (EC50)	rIP 530 nM (EC50)	hDP1 850 nM (EC50)		
In Vitro	Ralinepag is a potent non-prostanoid prostacyclin receptor agonist, with EC50s of 8.5 nM, 530 nM and 850 nM for human and rat IP receptor and human DP1 receptor, respectively. Ralinepag (5c) has potent receptor binding affinity at prostaglandin receptor, with Kis of 1.2 nM, 3 nM, 76 nM, and 256 nM for monkey, human, rat, and dog IP receptor (ligand, [3H]-iloprost), and 2.6 μM, 9.6 μM, 610 nM, 143 nM, and 678 nM for human DP1, EP1, EP2, EP3v6 and EP4 receptors (ligand, [3H]-PGE2), respectively. Moreover, Ralinepag shows no effect on cytochrome P450 enzymes (IC50 > 50 μM for CYPs 1A2, 2D6, 3A4 2C8, 2C9, and 2C19) or hERG channel functional activity in a patch clamp assay (IC50 > 30 μM). Ralinepag also inhibits the ADP-induced human platelet aggregation, with an IC50 of 38 nM[1]。				
In Vivo	Ralinepag (30 mg/kg, p.o.) markedly reduces the monocrotaline (MCT)-induced increase in pulmonary arterial pressure and pulmonary vessel wall thickness in rats[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 100 mg/mL (231.53 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				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.3153 mL	11.5765 mL	23.1530 mL
		5 mM	0.4631 mL	2.3153 mL	4.6306 mL
		10 mM	0.2315 mL	1.1576 mL	2.3153 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 → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.79 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 2.5 mg/mL（饱和度和未知）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 $\rightarrow$ 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.79 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: ≥ 2.5 mg/mL (5.79 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]. Tran TA, et al. Discovery of 2-(((1r,4r)-4-(((4-Chlorophenyl)(phenyl)carbamoyl)oxy)methyl)cyclohexyl)methoxy)acetate (Ralinepag): An Orally Active Prostacyclin Receptor Agonist for the Treatment of Pulmonary Arterial Hypertension. J Med Chem. 2017 Feb 9;60(3):913-927.

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	2.3153 mL	11.5765 mL	23.1530 mL	57.8824 mL
	5 mM	0.4631 mL	2.3153 mL	4.6306 mL	11.5765 mL
	10 mM	0.2315 mL	1.1576 mL	2.3153 mL	5.7882 mL
	15 mM	0.1544 mL	0.7718 mL	1.5435 mL	3.8588 mL
	20 mM	0.1158 mL	0.5788 mL	1.1576 mL	2.8941 mL
	25 mM	0.0926 mL	0.4631 mL	0.9261 mL	2.3153 mL
	30 mM	0.0772 mL	0.3859 mL	0.7718 mL	1.9294 mL
	40 mM	0.0579 mL	0.2894 mL	0.5788 mL	1.4471 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: shyysw@sina.com

	50 mM	0.0463 mL	0.2315 mL	0.4631 mL	1.1576 mL
	60 mM	0.0386 mL	0.1929 mL	0.3859 mL	0.9647 mL
	80 mM	0.0289 mL	0.1447 mL	0.2894 mL	0.7235 mL
	100 mM	0.0232 mL	0.1158 mL	0.2315 mL	0.5788 mL



源叶