



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: LIT-927
CAS 号: 2172879-52-4
产品货号: S88593

生物活性:

Description	LIT-927 是局部的、有口服活性的 CXC 趋化因子 12 (CXCL12) 的中性配体, 具有抗炎作用, 对 CXCL12 结合到其受体 CXCR4 的 Ki 值为 267 nM。				
IC50 & Target[1]	CXCL12/CXCR4 267 nM (Ki)				
In Vitro	LIT-927 is a locally and orally active CXCL12 neutraligand with anti-inflammatory effect, with a Ki of 267 nM for CXCL12 binding to CXCR4. Compounds 50, 57 (LIT-927), 65, and 67 are the most potent and soluble cyclic neutraligands identified in vitro and are representative of four novel chemotypes: pyrazoline, pyrimidinone, benzofuranone, and chromanone. LIT-927 is bound to a wide and accessible pocket, which is incompatible with the observed nanomolar binding affinities of our neutraligands[1]。				
In Vivo	LIT-927 (compound 57) reduces eosinophil recruitment in a murine model of allergic airway hypereosinophilia, LIT-927 is the only one to display inhibitory activity following oral administration. Combined with a high binding selectivity for CXCL12 over other chemokines, LIT-927 represents a powerful pharmacological tool to investigate CXCL12 physiology in vivo and to explore the activity of chemokine neutralization in inflammatory and related diseases[1].				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 12.5 mg/mL (38.02 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	10 mg
		1 mM	3.0418 mL	15.2091 mL	30.4182 mL
		5 mM	0.6084 mL	3.0418 mL	6.0837 mL
		10 mM	0.3042 mL	1.5209 mL	3.0418 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, 6 months; -20°C, 1 month。-80°C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20°C 储存时, 请在 1 个月内使用。 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: ≥ 1.25 mg/mL (3.80 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 1.25 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 12.5 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					



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

	mL。 生理盐水的配制: 将 0.9 g 氯化钠, 溶解于 ddH ₂ O 并定容至 100 mL, 可以得到澄清透明的生理盐水溶液。
参考文献	[1]. Regenass P, et al. Discovery of a Locally and Orally Active CXCL12 Neutraligand (LIT-927) with Anti-inflammatory Effect in a Murine Model of Allergic Airway Hypereosinophilia. J Med Chem. 2018 Sep 13;61(17):7671-7686.

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, 6 months; -20° C, 1 month。 -80° C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20° C 储存时, 请在 1 个月内使用。

可选溶剂	质量 溶剂体积 浓度	1 mg	5 mg	10 mg	25 mg
DMSO	1 mM	3.0418 mL	15.2091 mL	30.4183 mL	76.0456 mL
	5 mM	0.6084 mL	3.0418 mL	6.0837 mL	15.2091 mL
	10 mM	0.3042 mL	1.5209 mL	3.0418 mL	7.6046 mL
	15 mM	0.2028 mL	1.0139 mL	2.0279 mL	5.0697 mL
	20 mM	0.1521 mL	0.7605 mL	1.5209 mL	3.8023 mL
	25 mM	0.1217 mL	0.6084 mL	1.2167 mL	3.0418 mL
	30 mM	0.1014 mL	0.5070 mL	1.0139 mL	2.5349 mL

源叶