



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

产品名称: **GSK-7975A**
CAS 号: **1253186-56-9**
产品货号: **S89015**

生物活性:

Description	GSK-7975A 是高效有口服活性的 CRAC 通道抑制剂。				
In Vitro	GSK-7975A 减少 FcεRI 依赖性 Ca2+ 内流和 3 μM GSK-7975A 减少组胺、白三烯 C4 和细胞因子 (IL-5/-8/-13 和 TNFα) 的释放达到 50%[1]。 GSK-7975A 在多种物种中抑制肥大细胞的介质释放和 T 细胞的促炎细胞因子释放。GSK-7975A 完全抑制通过 CRAC 通道的钙内流。这导致抑制来自多种人和大鼠制剂的肥大细胞介质和 T 细胞细胞因子的释放。GSK-7975A 不抑制豚鼠和小鼠肥大细胞; 然而, 在小鼠制剂中, T 细胞的细胞因子释放被完全阻断[2]。 GSK-7975A 在小鼠和人类中以浓度依赖性方式抑制 Ca2+ 释放后毒素诱导的 ORAI1 激活和/或 Ca2+ 电流激活胰腺腺泡细胞 (在对照细胞中观察到的水平的抑制 >90%)。GSK-7975A 还可防止小鼠和人类胰腺腺泡细胞坏死细胞死亡通路的激活[3]。				
	GSK-7975A 以剂量和时间依赖性方式抑制 TLCS-AP、CER-AP、FAEE-AP 中急性胰腺炎的局部和全身特征。GSK-7975A 显著降低血清淀粉酶、il - 6 和胰腺 MPO 水平的升高;肺 MPO 仅在低剂量时显著降低。GSK-7975A 可显著降低 TLCS-AP、CER-AP 和 FAEE-AP 的胰腺组织病理学[3]。				
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : ≥ 90 mg/mL (226.53 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	2.5170 mL	12.5849 mL	25.1699 mL
		5 mM	0.5034 mL	2.5170 mL	5.0340 mL
		10 mM	0.2517 mL	1.2585 mL	2.5170 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 (6.29 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 (6.29 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 → 90% Corn Oil Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (6.29 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]. Ashmole I, et al. CRACM/Orai ion channel expression and function in human lung mast cells. J Allergy Clin Immunol. 2012 Jun;129(6):1628-35.e2. [2]. Rice LV, et al. Characterization of selective Calcium-Release Activated Calcium channel blockers in mast cells and T-cells from human, rat, mouse and guinea-pig preparations. Eur J Pharmacol. 2013 Mar 15;704(1-3):49-57. [3]. Wen L, et al. Inhibitors of ORAI1 Prevent Cytosolic Calcium-Associated Injury of Human Pancreatic Acinar Cells and Acute Pancreatitis in 3 Mouse Models. Gastroenterology. 2015 Aug;149(2):481-92.e7.				
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	2.5170 mL	12.5849 mL	25.1699 mL	62.9247 mL
	5 mM	0.5034 mL	2.5170 mL	5.0340 mL	12.5849 mL
	10 mM	0.2517 mL	1.2585 mL	2.5170 mL	6.2925 mL
	15 mM	0.1678 mL	0.8390 mL	1.6780 mL	4.1950 mL
	20 mM	0.1258 mL	0.6292 mL	1.2585 mL	3.1462 mL
	25 mM	0.1007 mL	0.5034 mL	1.0068 mL	2.5170 mL
	30 mM	0.0839 mL	0.4195 mL	0.8390 mL	2.0975 mL
	40 mM	0.0629 mL	0.3146 mL	0.6292 mL	1.5731 mL
	50 mM	0.0503 mL	0.2517 mL	0.5034 mL	1.2585 mL
	60 mM	0.0419 mL	0.2097 mL	0.4195 mL	1.0487 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

	80 mM	0.0315 mL	0.1573 mL	0.3146 mL	0.7866 mL
	100 mM	0.0252 mL	0.1258 mL	0.2517 mL	0.6292 mL



源叶