



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: **Seralutinib**
CAS 号: **1619931-27-9**
产品货号: **S89178**

生物活性:

Description	Seralutinib (GB002) 是一个可吸入的 PDGFR α 和 PDGFR β 激酶抑制剂。Seralutinib 同样抑制 CSF1R 和 c-KIT, IC50 分别为 8 nM 和 14 nM。Seralutinib (GB002) 可用于肺动脉高压的研究。			
IC50 & Target[2]	PDGFR α	PDGFR β	CSF1R 8 nM (IC ₅₀)	c-KIT 14 nM (IC ₅₀)
In Vitro	Seralutinib (GB002) (处理两周, 吸入给药) 显著降低右心室收缩压和平均肺动脉压。在经 Seralutinib (GB002) 处理的动物中, 血流动力学变化伴随着肺小动脉肌化减少和肺叶 BMPR2 蛋白表达的恢复。Seralutinib (GB002) 具有良好的耐受性[1]。 GB002 介导的健康 Sprague Dawley 大鼠吸入后立即抑制肺 PDGFR α / β 磷酸化[2]。 Seralutinib 呈剂量和时间依赖性诱导肺 BMPR2 蛋白表达[2]。			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 200 mg/mL (425.96 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	2.1298 mL	10.6489 mL
		5 mM	0.4260 mL	2.1298 mL
		10 mM	0.2130 mL	1.0649 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 → 90% (20% SBE-β-CD in Saline) Solubility: ≥ 5.75 mg/mL (12.25 mM); 澄清溶液 此方案可获得 ≥ 5.75 mg/mL (饱和度未知) 的澄清溶液。 以 1 mL 工作液为例, 取 100 μL 57.5 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 二 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO → 40% PEG300 → 5% Tween-80 → 45% Saline Solubility: ≥ 2.5 mg/mL (5.32 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 三 请依序添加每种溶剂: 10% DMSO $\rightarrow$ 90% Corn Oil Solubility: $\geq$ 2.5 mg/mL (5.32 mM); 澄清溶液 此方案可获得 $\geq$ 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]. Robert P. Frantz1, et.al. Phase 2 Clinical Study to Evaluate the Efficacy and Safety of Inhaled GB002 (Seralutinib) for the Treatment of World Health Organization Group 1 Pulmonary Arterial Hypertension [2]. Anna Galkin, et al. Abstract 11102: Gb002, A Novel Inhaled Pdgfr Kinase Inhibitor, Demonstrates Efficacy in the Su5416 Hypoxia Rat Model of Pulmonary Arterial Hypertension (pah). Circulation. 2019;140:A11102. [3]. Anna Galkin, et al. Pharmacologic Characterization of GB002, a Novel Inhaled PDGFR Kinase Inhibitor in Development for Pulmonary Arterial Hypertension (PAH).

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, 6 months; -20 $^{\circ}$ C, 1 month. -80 $^{\circ}$ C 储存时, 请在 6 个月内使用, -20 $^{\circ}$ 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	2.1298 mL	10.6489 mL	21.2979 mL	53.2447 mL
	5 mM	0.4260 mL	2.1298 mL	4.2596 mL	10.6489 mL
	10 mM	0.2130 mL	1.0649 mL	2.1298 mL	5.3245 mL
	15 mM	0.1420 mL	0.7099 mL	1.4199 mL	3.5496 mL
	20 mM	0.1065 mL	0.5324 mL	1.0649 mL	2.6622 mL
	25 mM	0.0852 mL	0.4260 mL	0.8519 mL	2.1298 mL
	30 mM	0.0710 mL	0.3550 mL	0.7099 mL	1.7748 mL
	40 mM	0.0532 mL	0.2662 mL	0.5324 mL	1.3311 mL
	50 mM	0.0426 mL	0.2130 mL	0.4260 mL	1.0649 mL
	60 mM	0.0355 mL	0.1775 mL	0.3550 mL	0.8874 mL
	80 mM	0.0266 mL	0.1331 mL	0.2662 mL	0.6656 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

	100 mM	0.0213 mL	0.1065 mL	0.2130 mL	0.5324 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶