



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: shyyw@sina.com

产品名称: **NIBR0213**
CAS 号: **1233332-14-3**
产品货号: **S89378**

生物活性:

Description	NIBR-0213 是一种有效的、具有口服活性的选择性 S1P1 拮抗剂, 对实验性自身免疫性脑脊髓炎有效。在 GTP γ 35S 试验中, NIBR-0213 有效作用于人和大鼠 S1P1, IC ₅₀ 分别为 2.0 nM 和 2.3 nM。			
Cellular Effect	Cell Line	Type	Value	Description
	CHO	IC ₅₀	2 nM	Antagonist activity at human S1P1 receptor expressed in CHO cells after 120 mins by [35S]GTPgammaS binding assay
	CHO	IC ₅₀	> 10 μ M	Antagonist activity at human S1P2 receptor expressed in CHO cells assessed as inhibition of agonist-induced calcium mobilization preincubated for 20 mins by Fluo-4/FLIPR method
	CHO	IC ₅₀	> 10 μ M	Antagonist activity at human S1P3 receptor expressed in CHO cells assessed as inhibition of agonist-induced calcium mobilization preincubated for 20 mins by Fluo-4/FLIPR method
	CHO	IC ₅₀	> 10 μ M	Antagonist activity at human S1P4 receptor expressed in CHO cells assessed as inhibition of agonist-induced calcium mobilization preincubated for 20 mins by Fluo-4/FLIPR method
	CHO	IC ₅₀	> 10 μ M	Antagonist activity at human S1P5 receptor expressed in CHO cells after 120 mins by [35S]GTPgammaS binding assay
	CHO	IC ₅₀	> 10 μ M	Antagonist activity at human S1P5 receptor expressed in CHO cells after 120 mins by [35S]GTPgammaS binding assay
In Vitro	NIBR-0213 对 hS1P1 表现出抑制活性, IC₅₀ 为 2.5 nM, 而在 Ca²⁺ 动员试验中对 S1P2、S1P3 和 S1P4 无活性 (IC₅₀ > 10 μM) [1]。 NIBR-0213 在 GTP γ 35S 试验中对人类和大鼠 S1P1 (IC₅₀ 分别为 2.0 nM 和 2.3 nM) 表现出强效且相当的效力, 而对小鼠 S1P1 的 IC₅₀ 为 8.5 nM[1]。 NIBR-0213 对人类 S1P5 显示出约 3,000 倍的选择性 GTP γ 35S 测定[1]。 NIBR-0213 是一种竞争性 S1P1 拮抗剂, 计算出的 K_d 为 0.37$\pm$0.031 nM[1]。			
In Vivo	NIBR-0213 (大鼠口服 30 mg/kg) 可在 14 小时内使外周血淋巴细胞 (PBL) 计数降低 75%-85%, 且这种效果可持续至治疗后 24 小时[1]。 NIBR-0213 (30 mg/kg 和 60 mg/kg) 在小鼠实验性自身免疫性脑脊髓炎 (EAE) 模型中治疗有效 [1]。 NIBR-0213 的 PK 特性显示其具有中等清除率 (26 mL/min/kg) 和高口服生物利用度 (69%), 口服给药后可产生显著的暴露量[1]。			
	Animal Model:	Lewis or Wistar rats (220-250 g, males)[1]		
	Dosage:	30 mg/kg		
	Administration:	Orally		
	Result:	Reduced the PBL counts by 75%-85% within 14 hr and maintained this effect up to 24 hr posttreatment.		
	Animal Model:	C57BL/6 mice bearing EAE model[1]		
	Dosage:	30 mg/kg and 60 mg/kg		
	Administration:	30 mg/kg twice per day (BID) for 3 days and then increased to 60 mg/kg BID until the remainder of the experiment. In total, the treatment lasted 26 days		



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

	Result:	Resulted in a gradual reduction in disease-scores, with a divergence from vehicle controls that became significant after 5 days.			
Solvent&Solubility	细胞实验: DMSO 中的溶解度 : 100 mg/mL (215.06 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) Ethanol 中的溶解度 : ≥ 25 mg/mL (53.77 mM) * "≥" means soluble, but saturation unknown				
	Preparing Stock Solutions	Solvent / Mass Concentration	1 mg	5 mg	10 mg
		1 mM	2.1506 mL	10.7532 mL	21.5063 mL
		5 mM	0.4301 mL	2.1506 mL	4.3013 mL
		10 mM	0.2151 mL	1.0753 mL	2.1506 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 (sealed storage, away from moisture)。-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。				
参考文献	[1]. Jean Quancard, et al. A potent and selective SIP(1) antagonist with efficacy in experimental autoimmune encephalomyelitis. Chem Biol. 2012 Sep 21;19(9):1142-51.				
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 (sealed storage, away from moisture)。-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
Ethanol / DMSO	1 mM	2.1506 mL	10.7532 mL	21.5063 mL	53.7658 mL
	5 mM	0.4301 mL	2.1506 mL	4.3013 mL	10.7532 mL
	10 mM	0.2151 mL	1.0753 mL	2.1506 mL	5.3766 mL
	15 mM	0.1434 mL	0.7169 mL	1.4338 mL	3.5844 mL
	20 mM	0.1075 mL	0.5377 mL	1.0753 mL	2.6883 mL
	25 mM	0.0860 mL	0.4301 mL	0.8603 mL	2.1506 mL
	30 mM	0.0717 mL	0.3584 mL	0.7169 mL	1.7922 mL
	40 mM	0.0538 mL	0.2688 mL	0.5377 mL	1.3441 mL
	50 mM	0.0430 mL	0.2151 mL	0.4301 mL	1.0753 mL
DMSO	60 mM	0.0358 mL	0.1792 mL	0.3584 mL	0.8961 mL
	80 mM	0.0269 mL	0.1344 mL	0.2688 mL	0.6721 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	0.0215 mL	0.1075 mL	0.2151 mL	0.5377 mL
--	--------	-----------	-----------	-----------	-----------



源叶